

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2000-344666

(P2000-344666A)

(43) 公開日 平成12年12月12日 (2000. 12. 12)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テマート* (参考)
A 6 1 K 31/192		A 6 1 K 31/192	4 C 0 5 5
31/216		31/216	4 C 0 8 6
31/44		31/44	4 C 2 0 6
31/4402		31/4402	4 H 0 0 6
A 6 1 P 1/18		A 6 1 P 1/18	
審査請求 未請求 請求項の数70 O L (全317頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号 特願2000-98322(P2000-98322)

(22) 出願日 平成12年3月31日 (2000. 3. 31)

(31) 優先権主張番号 特願平11-94840

(32) 優先日 平成11年4月1日 (1999. 4. 1)

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000001856

三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号

(72) 発明者 柳澤 宏明

東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

(72) 発明者 櫻井 満也

東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号
三共株式会社内

(74) 代理人 100081400

弁理士 大野 彰夫 (外2名)

最終頁に続く

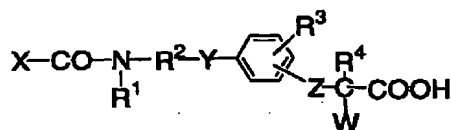
(54) 【発明の名称】 糖及び脂質代謝改善剤

(57) 【要約】

【課題】糖尿病、高脂血症、動脈硬化症、高血圧症等の治療剤および／または予防剤として有用なアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを提供する。

【解決手段】 一般式

【化1】



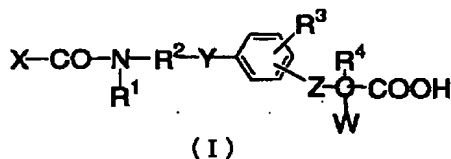
(式中、R¹ は水素原子等を示し、R² はアルキレン基を示し、R³ は水素原子等を示し、R⁴ は水素原子等を示し、Xは置換もしくは無置換のアリール基等を示し、Yは酸素原子等を示し、Zはアルキレン基等を示し、Wはアルキル基等を示す。) を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(2)

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 一般式

【化1】



〔式中、

R¹は水素原子、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし12個を有するアラルキル基を示し、

R²は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基を示し、

R³は (i) 水素原子、(i i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) ハロゲン原子、(v i) ニトロ基、(v i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(v i i i) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(i x) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(x) ヒドロキシ基または(x i) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示し、

R⁴は水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示し、

Zは炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基を示し、

Wは (i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) ヒドロキシ基、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x) アリール部分に1ないし5個の後述する置換

分 α を有しているもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(x i) アリール部分が1ないし5個の後述する置換分 α を有しているもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(x i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基、(x i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基、(x i v) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基、(x v) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環基、(x v i) アミノ基、(x v i i) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、(x v i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(x i x) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有しているもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリールアミノ基、(x x) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有しているもよい炭素数6ないし10個を有するアリールアミノ基、(x x i) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有しているもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基または

(x x i i) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラルキルを有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示し、

Xは、Wが（a）炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、（b）ヒドロキシ基、

(c) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(d) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(e) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(f) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、

(g) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(h) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(i) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7な

(3)

3

いし12個を有するアラルキルオキシ基、(j)アリアル部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(k)アリアル部分が1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリアルオキシアルキル基、(l)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基、(m)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基、(n)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基または(o)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環基を示すときは、1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル基または1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示し、あるいは、Xは、Wが(a)アミノ基、(b)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、(c)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(d)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルを有するN-アルキル-N-アリアルアミノ基、(e)アリアル部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルアミノ基、(f)アリアル部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基または(g)アリアル部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラルキルを有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示すときは、1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル基を示し、

上記置換分 α は (i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状も

4

しくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)ニトロ、(xiv)シアノ、(xv)アミノ、(xvi)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(xvii)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(xviii)アラルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ、(xix)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xx)アリアル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(xxi)同一または異なって1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル、(xxii)アリアル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルオキシ、(xxiii)アリアル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルチオ、(xxiv)アリアル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルスルホニル、(xxv)アリアル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(xxvi)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(xxvii)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(xxviii)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ、(xxix)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子

(4)

5

からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環スルホニル、(x x x) 複素芳香環部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環スルホニルアミノ (該アミノ部分の窒素原子は炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および (x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、上記置換分 β は (i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) 炭素数 1 ないし 5 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、(i x) ハロゲン原子、(x) ニトロ、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) アミノ、(x i v) アルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(x v i i) モノアルキルアミノ部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを 1 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル、(x v i i i) ジアルキルアミノ部分が同一または異なって炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを 2 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるジアルキルアミノアルキル、(x i x) アルコキシ部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノまたは (x x) アラルキル部分が炭素数 7 ないし 12 個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノを示し、

Y は単結合、酸素原子、硫黄原子または式 $>N-R^5$ を有する基 (式中、 R^5 は水素原子、炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数 1 ないし 8 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基または炭素数 7 ないし 11 個を有する芳香

6

族アシル基を示す。) を示す。] を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 2】[請求項 1]において、 R^1 が水素原子、炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、または炭素数 7 ないし 9 個を有するアラルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 3】[請求項 1]において、 R^1 が水素原子、または炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 4】[請求項 1]において、 R^1 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 5】[請求項 1]ないし[請求項 4]より選択される 1 項において、 R^2 が炭素数 2 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 6】[請求項 1]ないし[請求項 4]より選択される 1 項において、 R^2 がエチレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 7】[請求項 1]ないし[請求項 6]より選択される 1 項において、 R^3 が水素原子、炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数 1 もしくは 2 個を有するアルコキシ基、炭素数 1 もしくは 2 個を有するアルキルチオ基、ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ基、または炭素数 1 ないし 5 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 8】[請求項 1]ないし[請求項 6]より選択される 1 項において、 R^3 が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 9】[請求項 1]ないし[請求項 6]より選択される 1 項において、 R^3 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

(5)

7

【請求項10】[請求項1]ないし[請求項9]より選択される1項において、 R^4 が水素原子、または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項11】[請求項1]ないし[請求項9]より選択される1項において、 R^4 が水素原子、またはメチル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項12】[請求項1]ないし[請求項9]より選択される1項において、 R^4 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項13】[請求項1]ないし[請求項12]より選択される1項において、Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項14】[請求項1]ないし[請求項12]より選択される1項において、Zがメチレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項15】[請求項1]ないし[請求項14]より選択される1項において、 $-W$ が、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(vi)炭素数1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(viii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(ix)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(x)アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝

8

鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xi)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環基、(xii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基、(xiii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基、(xiv)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環基を示し、

ここに置換分 α^1 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換基分 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)ニトロ、(xiv)シアノ、(xv)アミノ、(xvi)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(xvii)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(xviii)アラルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ、(xix)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xx)アリール部分に1ないし3個の後述する置換基分 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(xxi)同一または異なって1ないし3個の後述する置換基分 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール、(xxii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換基分 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(xxiii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換基分 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(xxiv)ア

(6)

9

リアル部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル、(xxv)アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい)、(xxvi)1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(xxvii)1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(xxviii)1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ、(xxix)1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル、(xxx)複素芳香環部分に1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)および(xxxi)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^1 は、
 (i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(viii)ハロゲン原子、(ix)ニトロ、(x)ホルミル、(xi)シアノ、(xii)カルボキシル、(xiii)アミノ、(xiv)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(xv)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x

10

vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(xvii)モノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル、(xviii)ジアルキル部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキル、(xix)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノまたは(xx)アリール部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項16】[請求項1]ないし[請求項14]より選択される1項において、Wが、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii)ヒドロキシ基、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v)1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi)アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(xiii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基を示し、ここに置換分 α^2 は、(i)炭素数1ないし6個を有す

(7)

11

る直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 5 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(i x) ハロゲン原子、(x) ニトロ、(x i) シアノ、(x i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x i i i) 同一または異なって 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリール、(x i v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールオキシ、(x v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールチオ、(x v i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環、(x v i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環オキシ、(x v i i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環チオまたは (x i x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^2 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロシアルキル、(v) ハロゲン原子、(v i) ニトロ、(v i i) ホルミル、(v i i i) カルボキシル、(i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノまたは (x) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を 2 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であ

12

るジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 17】[請求項 1] ないし [請求項 14] より選択される 1 項において、W が、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i i i) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールオキシ基、(i v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールチオ基、(v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 7 ないし 12 個を有するアラルキル基、(v i) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数 1 ないし 4 個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(v i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環複素芳香環オキシ基または (i x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α^3 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(v i i) ハロゲン原子、(v i i i) シアノおよび (i x) ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項 18】[請求項 1] ないし [請求項 14] より選択される 1 項において、W が、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i i i) フェニル部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^4 を有していてもよいフェノキシ基、(i v) フェニル部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^4 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を

(8)

13

有するフェニルチオ基、(v)炭素数7ないし10個を有するアラルキル基、(vi)炭素数7ないし10個を有するアラルキルオキシ基、(vii)アリール部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状であり炭素数1ないし4個を有するアリールオキシアルキル基、(viii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(ix)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α 4は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノまたは(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項19】[請求項1]ないし[請求項14]より選択される1項において、Wがフェニル部分に1個の後述する置換分 α^5 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^5 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノまたは(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項20】[請求項1]ないし[請求項14]より選択される1項において、Wがフェニル部分に1個の後述する置換分 α^6 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^6 は、メチル、エチル、イソプロピル、 t -ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子または塩素原子からなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その

14

薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項21】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xが1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^7 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、

(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、

(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、

(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xiv)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(xv)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニル、(xvi)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェノキシ、(xvii)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルチオ、(xviii)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニル、(xix)フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい)、(xx)フリル、(xxi)チエニル、(xxii)オキサゾリル、(xxiii)イソオキサゾリル、(xxiv)チアゾリル、(xxv)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジル、(xxvi)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジリオキシ、(xxvii)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルチオ、(xxviii)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニル、(xxix)イミダゾリル(環の窒素

50

(9)

15

素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x x) ピリジル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)および(x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^3 は、

(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項22】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xが1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル基または1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、

ここに置換分 α^8 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) 同一もしくは異なって各アルキル

16

が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニル、(x i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェノキシ、(x i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニルチオ、(x i i i) フリル、(x i v) チエニル、(x v) オキサゾリル、(x v i) イソオキサゾリル、(x v i i) チアゾリル、(x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいピリジル、(x i x) イミダゾリル(環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)

および(x x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^4 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、

(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、

(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、

(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、

(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項23】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xが1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル基または1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、

ここに置換分 α^9 は、(i) ヒドロキシ、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(i v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を

(10)

17

有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、
 (v) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェニル、(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^5 は、

(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロシアルキル、(vi) ハロゲン原子、(vii) ニトロ、(viii) ホルミル、(ix) カルボキシル、
 (x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項24】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xが1ないし3個の後述する置換分 α^{11} を有していてもよいフェニル基、インドリル基、ピリジル基またはキノリル基であり、ここに置換分 α^{11} は、(i) ヒドロキシ、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(iv) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、
 (v) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいフェニル、(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^7 は、
 (i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1

18

ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロシアルキル、(vi) ハロゲン原子、(vii) ニトロ、(viii) ホルミル、(ix) カルボキシル、
 (x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項25】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xが1個の後述する置換分 α^{12} を有していてもよいフェニル基であり、

ここに置換分 α^{12} は、メチル、イソプロピル、ヒドロキシ、フッ素原子、塩素原子、ジエチルアミノ、ベンジル、フェニル（該フェニル部分は同一または異なって、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メチレンジオキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ホルミル、シアノ、カルボキシル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、もしくはN、N-ジメチルアミノメチルで1ないし3個置換されていてもよい。）、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、ピリジル（該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで置換されていてもよい。）、ピリジリオキシ、ピリジルチオ、ピリジルスルホニルおよびピペリジルからなる群から選択されるものである、あるいは、
 Xが1個の後述する置換分 α^{13} を有していてもよいピリジル基であり、ここに置換分 α^{13} は、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、ベンジリオキシ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル、ベンジル、フェニル（該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジエチルアミノで置換されていてもよい。）、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノおよびN-メチルフェニルスルホニルアミノからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

(11)

19

【請求項26】[請求項1]ないし[請求項20]より選択される1項において、Xがビフェニル基（該フェニル部分は同一または異なって、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ホルミル、カルボキシル、ニトロ、ジメチルアミノまたはN、N-ジメチルアミノメチルで1個置換されていてもよい。）、ピリジルフェニル基（該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジェチルアミノで1個置換されていてもよい。）またはフェニルピリジル基（該フェニル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、もしくはジメチルアミノで1個置換されていてもよい。）であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項27】[請求項1]ないし[請求項26]より選択される1項において、Yが単結合または酸素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項28】[請求項1]ないし[請求項26]より選択される1項において、Yが酸素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項29】[請求項1]において、
 R^1 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラルキル基であり； R^2 が炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり； R^3 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1もしくは2個を有するアルコキシ基、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ基、ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ基、または炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であり； R^4 が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり；Wが、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii)ヒドロキシ基、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v)1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有して

20

いてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi)アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環基、(xiii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基、(xiv)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基、(xv)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環基を示し、ここに置換分 α^1 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)ニトロ、(xiv)シアノ、(xv)アミノ、(xvi)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(xvii)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(xviii)アラルキル部分が炭素数7ないし

(12)

21

1 2個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ、
 (x i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1
 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキ
 ルアミノ、(x x) アリール部分に1ないし3個の後述
 する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし1
 2個を有するアラルキル、(x x i) 同一または異なっ
 て1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していても
 よい炭素数6ないし10個を有するアリール、(x x i
 i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1
 1を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するア
 リールオキシ、(x x i i i) アリール部分に1ないし
 3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数
 6ないし10個を有するアリールチオ、(x x i v) ア
 リール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有
 していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール
 スルホニル、(x x v) アリール部分に1ないし3個の
 後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ない
 し10個を有するアリールスルホニルアミノ (該アミノ
 部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状も
 しくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。
 (x x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^1
 1を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原
 子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個
 含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香
 環、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^1
 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原
 子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個
 含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オ
 キシ、(x x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分
 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄
 原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4
 個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香
 環チオ、(x x i x) 1ないし3個の後述する置換分 β^1
 1を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原
 子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個
 含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環
 スルホニル、(x x x) 複素芳香環部分に1ないし3個
 の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒
 素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ
 原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ない
 し10員複素芳香環スルホニルアミノ (該アミノ部分の
 窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは
 分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および
 (x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる
 群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する
 1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる
 群から選択されるものを示し、
 ここに置換分 β^1 は、(i) 炭素数1ないし6個を有す
 る直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数
 1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲ

22

ン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数
 1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコ
 キシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは
 分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1
 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケ
 レンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直
 鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i
 i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、
 (x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i
 i) アミノ、(x i v) アルキル部分が炭素数1ないし
 4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルア
 ミノ、(x v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素
 数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアル
 キルアミノ、(x v i) 炭素数1ないし4個を有する
 直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(x v i
 i) モノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有
 する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアル
 キル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは
 分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキ
 ル、(x v i i i) ジアルキル部分が同一または異なっ
 て炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状
 のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし
 4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキル
 アミノアルキル、(x i x) アルコキシ部分が炭素数1
 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキ
 シカルボニルアミノまたは(x x) アリール部分が炭素
 数6ないし10個を有しアルキル部分が炭素数1ないし
 4個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノからなる
 群から選択されるものであり、Xが1ないし3個の後
 述する置換分 α^7 を有していてもよい炭素数6ないし1
 0個を有するアリール基または1ないし3個の後述する
 置換分 α^7 を有していてもよい酸素原子、窒素原子およ
 び硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1な
 いし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環
 の複素芳香環基であり、
 ここに置換分 α^7 は、(i) 炭素数1ないし6個を有す
 る直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数
 1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲ
 ン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数
 1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族
 アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖
 状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(v i) 炭素数1
 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキ
 シ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状も
 しくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i i) 炭
 素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアル
 ケレンジオキシ、(i x) 1ないし3個の後述する置
 換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有
 するアラルキルオキシ、(x) 炭素数1ないし4個を有
 する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(x i)

(13)

23

炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(x i i) ハロゲン原子、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x i v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキル、(x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニル、(x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェノキシ、(x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルチオ、(x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニル、(x i x) フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x) フリル、(x x i) チエニル、(x x i i) オキサゾリル、(x x i i i) イソオキサゾリル、(x x i v) チアゾリル、(x x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジル、(x x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルオキシ、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルチオ、(x x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニル、(x x i x) イミダゾリル(環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x x) ピリジル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)) および(x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^3 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミ

24

ノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり；Yが単結合または酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項30】[請求項1]において、

- 10 R¹ が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラキル基であり；R²が炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケレン基であり；R³ が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であり；R⁴が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Zがメチレン基であり；Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i) ヒドロキシ基、(i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) 1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(v i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(v i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(v i i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキル基、(x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキルオキシ基、(x i) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(x i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(x i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基を示し、ここに置換分 α^2 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数
- 20
- 30
- 40
- 50

(14)

25

1 ないし 5 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(i x) ハロゲン原子、(x) ニトロ、(x i) シアノ、(x i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x i i i) 同一または異なって 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリール、(x i v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールオキシ、(x v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換基分 β^2 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールチオ、(x v i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環、(x v i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環オキシ、(x v i i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員複素芳香環チオまたは (x i x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^2 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v) ハロゲン原子、(v i) ニトロ、(v i i) ホルミル、(v i i i) カルボキシル、(i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノまたは (x) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を 2 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり；X が 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい

26

炭素数 6 ないし 10 個を有するアリール基または 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^8 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 5 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニル、(x i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェノキシ、(x i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニルチオ、(x i i i) フリル、(x i v) チェニル、(x v) オキサゾリル、(x v i) イソオキサゾリル、(x v i i) チアゾリル、(x v i i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいピリジル、(x i x) イミダゾリル (環の窒素原子は炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および (x x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^4 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび (x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数 1 ないし 4 個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を 2 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミ

(15)

27

ノアルキルからなる群から選択されるものであり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項31】[請求項1]において、

R¹ が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラルキル基であり；R²が炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり；R³ が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であり；R⁴が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Zがメチレン基であり；Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(iv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、

(v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(vi) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(vii) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(ix) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α^3 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(vii) ハロゲン原子、(viii) シアノおよび(ix) ピリジルからなる群から選択されるものであり；Xが1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい酸素原子、窒素原子お

28

よび硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、

ここに置換分 α^9 は、(i) ヒドロキシ、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(iv) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、

(v) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェニル、(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、

ここに置換分 β^5 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(vi) ハロゲン原子、(vii) ニトロ、(viii) ホルミル、(ix) カルボキシル、(x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項32】[請求項1]において、

R¹ が水素原子であり；R²がエチレン基であり；R³ が水素原子であり；R⁴が水素原子であり；Zがメチレン基であり；Wが、フェニル部分に1個の後述する置換分 α^5 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^5 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v) 炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi) 炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のア

(16)

29

ルキルスルホニル (v i i) ハロゲン原子、(v i i i) シアノまたは (i x) ピリジルからなる群から選択されるものであり；Xが1個の後述する置換分 α^{12} を有

していてもよいフェニル基であり、ここに置換分 α^{12} は、メチル、イソプロピル、ヒドロキシ、フッ素原子、塩素原子、ジェチルアミノ、ベンジル、フェニル（該フェニル部分は同一または異なって、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メチレンジオキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ホルミル、シアノ、カルボキシル、ジメチルアミノ、ジェチルアミノ、もしくはN、N-ジメチルアミノメチルで1ないし3個置換されていてもよい。）、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、ピリジル（該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジェチルアミノで置換されていてもよい。）、ピリジジオキシ、ピリジルトチオ、ピリジルスルホニルおよびピペリジルからなる群から選択されるものである、あるいは、

Xが1個の後述する置換分 α^{13} を有していてもよいピリジル基であり、ここに置換分 α^{13} は、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、ベンジジオキシ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル、ベンジル、フェニル（該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジェチルアミノで置換されていてもよい。）、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノおよびN-メチルフェニルスルホニルアミノからなる群から選択されるものであり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項33】[請求項1]において、

R¹ が水素原子であり；R²がエチレン基であり；R³ が水素原子であり；R⁴が水素原子であり；Zがメチレン基であり；Wが、フェニル部分に1個の後述する置換分 α^6 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^6 は、メチル、エチル、イソプロピル、t-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子または塩素原子からなる群から選択されるものであり；Xがビフェニル基（該フェニル部分は同一または異なって、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ホルミル、カルボキシル、ニト

30

ロ、ジメチルアミノまたはN、N-ジメチルアミノメチルで1個置換されていてもよい。）、ピリジルフェニル基（該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジェチルアミノで1個置換されていてもよい。）またはフェニルピリジル基（該フェニル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、もしくはジメチルアミノで1個置換されていてもよい。）であり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項34】[請求項1]において、

R¹ が水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；R²が炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり；R³ が、(i) 水素原子、(i i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) ハロゲン原子、(v i) ニトロ基、(v i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または---(i x)-アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアララルキル基であり；R⁴が---水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり；Wが、エチル基、プロピル基、ブチル基、ペンチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、フェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基または4-フェニルブチル基であり；Xが1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基であり、

ここに置換分 α は (i) 炭素数1ないし6個を有する

6) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメチル

(18)

33

アミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

7) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

8) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

9) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

10) 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

11) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

12) 2-ブチル-3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

13) 2-ブチル-3-[4-[2-(4-ジエチルアミノベンゾイルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

14) 2-ブチル-3-[4-[3-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] プロボキシ] フェニル] プロピオン酸

15) 2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

16) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

17) 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

18) 3-[4-[2-(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

19) 3-[4-[2-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

20) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

21) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

22) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

34

23) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

24) 3-[4-[2-[2-(4-フルオロフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

25) 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロボキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

26) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

27) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-[6-(5-ニトロピリジン-2-イル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

28) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-メトキシピリジン-2-イル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

29) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

30) 2-(4-メトキシフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

31) 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

32) 2-(4-メチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

33) 2-(4-tert-ブチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

34) 2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

35) 2-(4-クロロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

36) 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

37) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)

(19)

35

－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

38) 2－(3-フルオロフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

39) 2－(3, 5-ジフルオロフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

40) 2－(3, 4-ジフルオロフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

41) 2－(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

42) 2－(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

43) 2-メチル-2-フェノキシ-3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

44) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－2-メチル-3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

45) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－[2－(4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]－2-メチルプロピオン酸

46) 3－[4－[2－[2－(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]－2－(4-イソプロピルフェノキシ)－2-メチルプロピオン酸

からなる群から選択されるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項36】[請求項1]において、

1) 2-エトキシ-3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

2) 3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル]－2-プロピルプロピオン酸

3) 2-ブチル-3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

4) 2-ブチル-3－[4－[2－(4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

5) 2-ブチル-3－[4－[2－(4'-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

36

6) 2-フェノキシ-3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

7) 3－[4－[2－(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]－2-フェノキシプロピオン酸

8) 3－[4－[2－(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]－2-フェノキシプロピオン酸

10 9) 3－[4－[2－(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]－2-フェノキシプロピオン酸

10) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

11) 3－[4－[2－(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]－2－(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

20 12) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－(2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸

13) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－[2－(4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

14) 3－[4－[2－[2－(4-フルオロフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]－2－(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

30 15) 3－[4－[2－[2－(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル]－2－(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

16) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(3-メトキシ-6-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

17) 2－(4-イソプロピルフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(3-ジメチルアミノ-6-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

40 18) 2－(4-メトキシフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

19) 2－(4-メチルフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

20) 2－(4-tert-ブチルフェノキシ)－3－[4－[2－[4－(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

50 21) 2－(4-フルオロフェノキシ)－3－[4－

(20)

37

[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

22) 2-(4-クロロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

23) 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

24) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

25) 2-(3-フルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

26) 2-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

27) 2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

28) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸

29) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジル-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-メチルプロピオン酸

30) 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジル-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸

からなる群から選択されるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する血糖降下作用剤。

【請求項37】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる脂質低下作用剤。

【請求項38】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなるインスリン抵抗性改善作用剤。

【請求項39】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる抗炎症作用剤。

【請求項40】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる免疫調節作用剤。

38

【請求項41】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなるアルドース還元酵素阻害作用剤。

【請求項42】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる5-リポキシゲナーゼ阻害作用剤。

【請求項43】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる過酸化脂質生成抑制作用剤。

【請求項44】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなるPPAR活性化作用剤。

【請求項45】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる抗骨粗鬆症作用剤。

【請求項46】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルからなる神経細胞死阻害作用剤。

【請求項47】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する糖尿病の治療剤または予防剤。

【請求項48】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する高脂血症の治療剤または予防剤。

【請求項49】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する肥満症の治療剤または予防剤。

【請求項50】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する耐糖能不全症の治療剤または予防剤。

【請求項51】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有するインスリン抵抗性非耐糖能不全症の治療剤または予防剤。

【請求項52】【請求項1】ないし【請求項36】から選択される1項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを

(21)

39

有効成分として含有する高血圧症の治療剤または予防剤。

【請求項 5 3】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する脂肪肝の治療剤または予防剤。

【請求項 5 4】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する糖尿病合併症の治療剤または予防剤。

【請求項 5 5】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する動脈硬化症の治療剤または予防剤。

【請求項 5 6】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する妊娠糖尿病の治療剤または予防剤。

【請求項 5 7】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する多嚢胞卵巣症候群の治療剤または予防剤。

【請求項 5 8】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有するアテローム性動脈硬化症の治療剤または予防剤。

【請求項 5 9】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する骨関節炎の治療剤または予防剤。

【請求項 6 0】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有するリウマチ性関節炎の治療剤または予防剤。

【請求項 6 1】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有するアレルギー性疾患の治療剤または予防剤。

【請求項 6 2】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する喘息疾患の治療剤または予防

40

剤。

【請求項 6 3】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する癌疾患の治療剤または予防剤。

【請求項 6 4】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する自己免疫疾患の治療剤または予防剤。

【請求項 6 5】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する肺炎の治療剤または予防剤。

【請求項 6 6】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する骨粗鬆症の治療剤または予防剤。

【請求項 6 7】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する白内障の治療剤または予防剤。

【請求項 6 8】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する脳卒中の治療剤または予防剤。

【請求項 6 9】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有するアルツハイマー病の治療剤または予防剤。

【請求項 7 0】【請求項 1】ないし【請求項 3 6】から選択される 1 項に記載のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する筋ジストロフィーの治療剤または予防剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、優れた血糖降下作用(糖代謝改善作用)、脂質低下作用(脂質代謝改善作用)、インスリン抵抗性改善作用、抗炎症作用、免疫調節作用、アルドース還元酵素阻害作用、5- α リポキシゲナーゼ阻害作用、過酸化脂質生成抑制作用、PPAR (ペルオキシソーム・プロリフェレーター・アクティベーター・レセプター)活性化作用、抗骨粗鬆症作用および神経細胞死阻害作用を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルに関する。

【0002】更に、本発明は上記アミドカルボン酸誘導

(22)

41

体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する、糖尿病、高脂血症、肥満症、耐糖能不全 (impaired glucose tolerance: IGT)、インスリン抵抗性非耐糖能不全 (insulin resistant non-IGT: NGT)、高血圧症、脂肪肝、糖尿病合併症 (例えば網膜症、腎症、神経症、白内障、冠動脈疾患等)、動脈硬化症、妊娠糖尿病 (gestational diabetes mellitus: GDM)、多嚢胞卵巣症候群 (polycystic ovary syndrome: PCOS)、アテローム性動脈硬化症により惹起される細胞損傷 (例えば脳卒中により惹起される脳損傷等) のような、主にインスリン抵抗性に起因する疾病; 骨関節炎、疼痛、発熱、リウマチ性関節炎、炎症性腸炎、アクネ、日焼け、乾癬、湿疹、アレルギー性疾患、喘息、GI潰瘍、癌、悪液質、自己免疫疾患、肺炎のような炎症性疾患; 骨粗鬆症; 白内障; 脳卒中、炎症性脳疾患、神経変性疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病のような神経系疾患; 筋ジストロフィー; 等の予防または治療のための組成物、これら疾病の治療または予防のための医薬を製造するためのそれらの使用、あるいはそれらの薬理的な有効量を温血動物に投与することからなる治療方法または予防方法に関する。

【0003】

【従来の技術】従来、糖尿病、高血糖症治療薬として、インシュリンおよびトルブタミド、グリピジド等のスルホニル尿素化合物が使用されているが、最近、インシュリン非依存性糖尿病治療薬として、カルボン酸誘導体が報告されている。これらの化合物は例えば、

(1-1) WO91/19702号国際公開公報 (= 特表平5-507920号) ...

(1-2) WO94/29285号国際公開公報

(1-3) WO94/29302号国際公開公報

(1-4) WO95/03288号国際公開公報

(1-5) WO96/04260号国際公開公報

に記載されている。

【0004】しかしながら、上記で述べた化合物は、カルボン酸誘導体の側鎖にアミド結合を有するという後述する本発明の化合物の特徴を有していない点で異なる。

【0005】側鎖にアミド結合を有する化合物は、例えば

(2-1) 特開平6-172339号

(2-2) WO92/07850号国際公開公報 (= 特表平6-502144号)

(2-3) USP 5330998

に記載されている。

【0006】しかしながら、これらの化合物は末端にチアゾリジル基等を有する点で後述する本発明の化合物とは異なる。

【0007】側鎖にアミド結合を有するカルボン酸誘導体は、例えば、

(3-1) 特開平5-155828号

42

(3-2) 特開平5-279353号

に記載されているが、(3-1)の化合物はその作用 (血小板凝集阻止) およびカルボン酸の2ないし5位にアミノ基等を有しかつ側鎖末端が複素環等を有する点で、(3-2)の化合物はその作用 (虚血性組織に対する損傷の予防) および酢酸誘導体である点で本発明とは異なる。

【0008】

【発明が解決しようとする課題】本発明者らは強い血糖降下作用、脂質低下作用、インスリン抵抗性改善作用、抗炎症作用、免疫調節作用、アルドース還元酵素阻害作用、5-リポキシゲナーゼ阻害作用、過酸化脂質生成抑制作用、PPAR (ペルオキシソーム・プロリフェレーター・アクティベーター・レセプター) 活性化作用、抗骨粗鬆症作用および神経細胞死阻害作用等を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはそのエステルについて鋭意研究を行ない、本発明を完成した。

【0009】即ち、本発明は糖尿病、高脂血症、肥満症、耐糖能不全、インスリン抵抗性非耐糖能不全、高血圧症、脂肪肝、糖尿病合併症 (例えば網膜症、腎症、神経症、白内障、冠動脈疾患等)、動脈硬化症、妊娠糖尿病、多嚢胞卵巣症候群、アテローム性動脈硬化症により惹起される細胞損傷 (例えば脳卒中により惹起される脳損傷等) のような、主にインスリン抵抗性に起因する疾病; 骨関節炎、疼痛、発熱、リウマチ性関節炎、炎症性腸炎、アクネ、日焼け、乾癬、湿疹、アレルギー性疾患、喘息、GI潰瘍、癌、悪液質、自己免疫疾患 (例えば全身性エリテマトーデス、若年性関節リウマチ、シェーグレン症候群、全身性強皮症、混合型結合組織病、皮膚筋炎、橋本病、原発性粘液水腫、甲状腺中毒症、悪性貧血、潰瘍性大腸炎、自己免疫性萎縮性胃炎、特発性 Addison 病、男性不妊症、Goodpasture 症候群、急性進行性糸球体腎炎、重症筋無力症、多発性筋炎、尋常性天疱瘡、水疱性類天疱瘡、交感性眼炎、多発性硬化症、自己免疫性溶血性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、リウマチ熱、ルポイド肝炎、原発性胆汁性肝硬変症、ベーチェット病、CREST 症候群等)、肺炎のような炎症性疾患; 骨粗鬆症; 白内障; 脳卒中、炎症性脳疾患、神経変性疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病のような神経系疾患; 筋ジストロフィー; 等の予防剤および/または治療剤として有用な新規アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを提供する。更に、本発明は新規アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する医薬を提供する。

【0010】

【課題を解決するための手段】本発明は、一般式 (I)

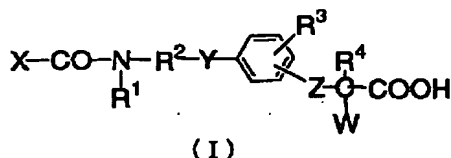
【0011】

50

(23)

43

【化 2】



を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルに関する。

【0012】上記式中、 R^1 は水素原子、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし12個を有するアラルキル基を示し、 R^2 は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基を示し、 R^3 は (i) 水素原子、(ii) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、

(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) ハロゲン原子、(vi) ニトロ基、(vii) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(viii) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(ix) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(x) ヒドロキシ基または(xi) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示し、 R^4 は水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示し、Zは炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基を示し、Wは (i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) ヒドロキシ基、

(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、

(v) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi) アリール部分が1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭

44

素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基、(xiii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基、(xiv) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基、(xv) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環基、(xvi) アミノ基、(xvii) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、

(xviii) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(xix) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリールアミノ基、(xx) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールアミノ基、(xxi) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基または(xxii) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラルキルを有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示し、Xは、Wが (a) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(b) ヒドロキシ基、(c) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(d) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(e) 1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、

(f) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(g) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(h) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(i) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(j) アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(k) アリール部分が1ないし5個

(24)

45

の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(l)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基、(m)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基、(n)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基または(o)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環基を示すときは、1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示し、あるいは、Xは、Wが(a)アミノ基、(b)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、(c)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、(d)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリールアミノ基、(e)アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールアミノ基、

(f)アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキルアミノ基または(g)アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラキルを有するアラキルオキシカルボニルアミノ基を示すときは、1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示し、上記置換分 α は (i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状

46

もしくは分枝鎖状のアルケレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)ニトロ、(xiv)シアノ、(xv)アミノ、(xvi)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(xvii)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(xviii)アラキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラキルオキシカルボニルアミノ、(xix)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xx)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキル、(xxi)同一または異なって1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール、(xxii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(xxiii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(xxiv)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル、(xxv)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(xxvi)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(xxvii)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(xxviii)1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル、(xxx)複素芳香環部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群か

(25)

47

ら選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)および(x x x i)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、上記置換分βは(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i)ヒドロキシ、(i v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、

(v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアリル、(v i i i)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、(i x)ハロゲン原子、(x)ニトロ、

(x i)シアノ、(x i i)カルボキシル、(x i i i)アミノ、(x i v)アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x v i)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(x v i i)モノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル、(x v i i i)ジアルキルアミノ部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるジアルキルアミノアルキル、(x i x)アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノまたは(x x)アルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラキルオキシカルボニルアミノを示し、Yは単結合、酸素原子、硫黄原子または式 >N-R^5 を有する基(式中、R⁵は水素原子、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。)を示す。

【0013】ここに、R¹、R³、R⁴、R⁵およびWが炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示す場合、該アルキル基は、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブ

48

チル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピルまたは1,2,2-トリメチルプロピルであり得、好適にはR¹、R³、R⁴およびR⁵は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり、Wは炭素数2ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり、更に好適にはR¹、R³、R⁴およびR⁵はメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチルまたはイソブチルであり、Wはエチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチルまたはペンチルである。最適には、R¹およびR⁵は炭素数1もしくは2個を有するアルキル(特にメチル)であり、R³はメチル、エチルまたはイソプロピル(特にメチルまたはイソプロピル)であり、R⁴は炭素数1もしくは2個を有するアルキル(特にメチル)であり、Wはプロピル、ブチルまたはペンチル(特にプロピルまたはブチル)である。

【0014】R¹が炭素数7ないし12個を有するアラキル基を示す場合、該アラキル基は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基にアリール基が置換されている基であり、例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1-ナフチルメチルまたは2-ナフチルメチルであり得、好適にはベンジル、フェネチルまたは3-フェニルプロピルであり、更に好適には3-フェニルプロピルである。

【0015】R²およびZが炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基を示す場合、該アルキレン基は、例えばメチレン、エチレン、メチルエチレン、エチルエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1,2-ジメチルエチレン、トリメチレン、1-メチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、1,1-ジメチルトリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレンまたはヘキサメチレンであり得、R²は好適には炭素数2ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり、より好適には炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり、更に好適にはエチレン、トリメチレンまたはメチルエチレンである。最適にはエチレンである。Zは好適には炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基(例えばメチレン、エチレン、メチルエチレン、エチルエチレン、トリメチ

(26)

49

レン、1-メチルトリメチレンまたは2-メチルトリメチレン)であり、更に好適には炭素数1もしくは2個を有するアルキレン基である。最適にはメチレンである。

【0016】 R^3 およびWが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基を示す場合、該アルコキシ基は、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシまたはイソブトキシであり得、 R^3 は好適には、炭素数1ないし3個を有するアルコキシ基(特にメトキシ、エトキシまたはイソプロポキシ)であり、更に好適には炭素数1もしくは2個を有するアルコキシ基(特にメトキシ)である。Wは好適には炭素数1ないし3個を有するアルコキシ基であり、更に好適にはエトキシである。

【0017】 R^3 およびWが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基を示す場合、該アルキルチオ基は、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオまたはイソブチルチオであり得、 R^3 は好適には炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ基であり、更に好適にはメチルチオである。Wは好適には炭素数1ないし3個を有するアルキルチオ基(例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオまたはイソプロピルチオ)であり、更に好適にはメチルチオである。

【0018】 R^3 がハロゲン原子を示す場合、該ハロゲン原子は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子であり得、好適にはフッ素原子、塩素原子または臭素原子であり、更に好適にはフッ素原子または塩素原子である。

【0019】 R^3 およびWが同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基を示す場合、該ジアルキルアミノ基は、例えばジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ジブチルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノまたはN-エチル-N-イソプロピルアミノであり得、好適にはジメチルアミノまたはジエチルアミノであり、更に好適にはジエチルアミノである。

【0020】 R^3 およびWが1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、無置換アリール基は、例えばフェニルまたはナフチルであり得、好適にはフェニルである。置換アリール基は、例えばメチルフェニル、エチルフェニル、プロピルフェニル、イソプロピルフェニル、トリフルオロメチルフェニル、ヒドロキシフェニル、アセチルフェニル、メトキシフェニル、メチレンジオキシフェニル、ベンジルドキシフェニル、メチルチオフェニル、メタンスルホニルフェニル、フルオロフェニル、ジフルオロフェニル、クロロフェニル、ジクロロフ

50

フェニル、ニトロフェニル、(ジメチルアミノ)フェニル、ベンジルフェニル、ビフェニル、フェノキシフェニル、フェニルチオフェニル、フェニルスルホニルフェニル、(フェニルスルホニルアミノ)フェニル、ピリジルフェニル、ピリジルドキシフェニル、ピリジルチオフェニル、(ピリジルスルホニルアミノ)フェニル、メチルナフチル、トリフルオロナフチル、ヒドロキシナフチル、メトキシナフチル、フルオロナフチル、クロロナフチルまたはピリジルナフチルであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基であり、更に好適にはメチルフェニル、エチルフェニル、イソプロピルフェニル、メトキシフェニル、メチルチオフェニルまたはクロロフェニルである。

【0021】 R^3 およびWがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラールキル基を示す場合、該アラールキル基は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基に上記で述べたアリール基が置換されている基であり、例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、ナフチルメチル、メチルベンジル、トリフルオロメチルベンジル、メトキシベンジル、メチレンジオキシベンジル、メチルチオベンジル、メタンスルホニルベンジル、フルオロベンジル、クロロベンジル、2-(メチルフェニル)エチル、2-(メトキシフェニル)エチル、3-(メチルフェニル)プロピル、3-(メトキシフェニル)プロピル、4-(メチルフェニル)ブチルまたは4-(メトキシフェニル)ブチルであり得、 R^3 は好適にはベンジルまたはフェネチルであり、最適にはベンジルである。Wは好適にはアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラールキル基であり、さらに好適には炭素数7ないし10個を有するアラールキル基(例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピルまたは4-フェニルブチル)である。最適には3-フェニルプロピルまたは4-フェニルブチル(特に3-フェニルプロピル)である。

【0022】 R^3 が炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示す場合、該脂肪族アシル基は、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ピバロイルであり得、好適にはホルミル、アセチル、ピバロイルである。最適にはホルミルまたはアセチルである。

【0023】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基を示す場合、無置換アリールオキシ基は、例えばフェノキシまたはナフチルオキシであり得、好適にはフェノキシである。置換アリールオキシ基は、例えばメチルフェノキシ、エチルフェノキシ、ブ

(27)

51

ロピルフェノキシ、イソプロピルフェノキシ、 t -ブチルフェノキシ、トリフルオロメチルフェノキシ、メトキシフェノキシ、エトキシフェノキシ、イソプロポキシフェノキシ、トリフルオロメトキシフェノキシ、メチルチオフェノキシ、エチルチオフェノキシ、シアノフェノキシ、ホルミルフェノキシ、フルオロフェノキシ、ジフルオロフェノキシ、トリフルオロフェノキシ、ペンタフルオロフェノキシ、クロロフェノキシ、ジクロロフェノキシ、トリクロロフェノキシ、ピリジルフェノキシ、ビフェニリルオキシ、メタンスルホニルフェノキシ、メチルナフチルオキシ、エチルナフチルオキシ、プロピルナフチルオキシ、イソプロピルナフチルオキシ、 t -ブチルナフチルオキシ、トリフルオロメチルナフチルオキシ、メトキシナフチルオキシ、エトキシナフチルオキシ、イソプロポキシナフチルオキシ、トリフルオロメトキシナフチルオキシ、メチルチオナフチルオキシ、エチルチオナフチルオキシ、シアノナフチルオキシ、ホルミルナフチルオキシ、フルオロナフチルオキシ、ジフルオロナフチルオキシ、トリフルオロナフチルオキシ、ペンタフルオロナフチルオキシ、クロロナフチルオキシ、ジクロロナフチルオキシ、トリクロロナフチルオキシ、ピリジルナフチルオキシ、ビフェニリルオキシまたはメタンスルホニルナフチルオキシであり得、好適にはアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基であり、更に好適にはフェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよいフェノキシ基（特にフェニル部分に1個の後述する置換分 α を有していてもよいフェノキシ基）である。最適にはメチルフェノキシ、エチルフェノキシ、イソプロピルフェノキシ、 t -ブチルフェノキシ、トリフルオロメチルフェノキシ、メトキシフェノキシ、エトキシフェノキシ、トリフルオロメトキシフェノキシ、シアノフェノキシ、ホルミルフェノキシ、フルオロフェノキシ、ジフルオロフェノキシ、トリフルオロフェノキシ、ペンタフルオロフェノキシ、クロロフェノキシ、ジクロロフェノキシ、トリクロロフェノキシ、ピリジルフェノキシまたはメタンスルホニルフェノキシであり、更に最適にはメチルフェノキシ、エチルフェノキシ、イソプロピルフェノキシ、 t -ブチルフェノキシ、トリフルオロメチルフェノキシ、メトキシフェノキシ、エトキシフェノキシ、トリフルオロメトキシフェノキシ、シアノフェノキシ、ホルミルフェノキシ、フルオロフェノキシ、ジフルオロフェノキシ、トリフルオロフェノキシ、ペンタフルオロフェノキシ、クロロフェノキシ、ジクロロフェノキシ、トリクロロフェノキシまたはメタンスルホニルフェノキシであり、特に最適には4-メチルフェノキシ、4-イソプロピルフェノキシ、4- t -ブチルフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、4-トリフルオロメトキシフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシまたは4-クロロフ

52

ェノキシである。

【0024】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基を示す場合、無置換アリールチオ基は、例えばフェニルチオまたはナフチルチオであり得、好適にはフェニルチオである。置換アリールチオ基は、例えばメチルフェニルチオ、エチルフェニルチオ、プロピルフェニルチオ、イソプロピルフェニルチオ、メトキシフェニルチオ、エトキシフェニルチオ、メチルチオフェニルチオ、エチルチオフェニルチオ、ビフェニリルチオ、4-メタンスルホニルフェニルチオ、メチルナフチルチオ、エチルナフチルチオ、プロピルナフチルチオ、イソプロピルナフチルチオ、メトキシナフチルチオ、エトキシナフチルチオ、メチルチオナフチルチオ、エチルチオナフチルチオまたは4-メタンスルホニルナフチルチオであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基であり、更に好適にはフェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよいフェニルチオである。最適にはメチルフェニルチオ、イソプロピルフェニルチオまたはメトキシフェニルチオである。

【0025】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基を示す場合、無置換アラルキルオキシ基は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキルオキシ基に上記で述べたアリール基が置換されている基であり、例えばベンジルオキシ、フェネチルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-ナフチルメチルオキシまたは2-ナフチルメチルオキシであり得、好適には炭素数7ないし10個を有するアラルキルオキシ基であり、更に好適にはベンジルオキシまたはフェネチルオキシ（特にベンジルオキシ）である。置換アラルキルオキシ基は、例えばメチルベンジルオキシ、メトキシベンジルオキシ、2-（メチルフェニル）エトキシ、2-（メトキシフェニル）エトキシ、3-（メチルフェニル）プロポキシ、3-（メトキシフェニル）プロポキシ、4-（メチルフェニル）ブトキシまたは4-（メトキシフェニル）ブトキシであり得、好適にはアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基であり、更に好適にはメチルベンジルオキシまたは2-（メチルフェニル）エトキシである。

【0026】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基を示す場合、無置換アラルキルチオ基は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキルチオ基に上記で述べたアリール基が置換されている基であり、例えばベンジルチオ、フェネ

(28)

53

チルチオ、3-フェニルプロピルチオ、4-フェニルプロピルチオ、1-ナフチルメチルチオまたは2-ナフチルメチルチオであり得、好適にはベンジルチオまたはフェネチルチオであり、更に好適にはベンジルチオである。置換アラルキルチオ基は、例えばメチルベンジルチオ、メトキシベンジルチオ、2-(メチルフェニル)エチルチオ、2-(メトキシフェニル)エチルチオ、3-(メチルフェニル)プロピルチオ、3-(メトキシフェニル)プロピルチオ、4-(メチルフェニル)ブチルチオまたは4-(メトキシフェニル)ブチルチオであり得、好適にはアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基であり、更に好適にはメチルベンジルチオまたは2-(メチルフェニル)エチルチオである。

【0027】Wがアリール部分が1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基を示す場合、当該基は、例えばフェノキシメチル、2-フェノキシエチル、3-フェノキシプロピル、4-フェノキシブチル、ナフチルオキシメチル、2-ナフチルオキシエチル、3-ナフチルオキシプロピルまたは4-ナフチルオキシブチルであり得、好適にはアリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基であり、更に好適にはアリール部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状であり炭素数1ないし4個を有するアリールオキシアルキル基である。最適にはフェノキシメチル、2-フェノキシエチル、3-フェノキシプロピルまたは4-フェノキシブチルであり、更に最適には2-フェノキシエチルまたは3-フェノキシプロピル（特に2-フェノキシエチル）である。

【0028】Wが酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示す場合、当該基は、例えばフリル、チエニル、ピロリル、アゼピニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピラニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリルまたはベンゾオキサゾリルであり得、好適にはピロリル、イミダゾリル、フリル、チエニルまたはピリジルであり、更に好適にはピロリルまたはイミダゾリルである。

【0029】Wが酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキ

54

シ基を示す場合、当該基は、例えばフリルオキシ、チエニルオキシ、ピロリルオキシ、アゼピニルオキシ、ピラゾリルオキシ、イミダゾリルオキシ、オキサゾリルオキシ、イソキサゾリルオキシ、チアゾリルオキシ、イソチアゾリルオキシ、1,2,3-オキサジアゾリルオキシ、トリアゾリルオキシ、テトラゾリルオキシ、チアジアゾリルオキシ、ピラニルオキシ、ピリジルオキシ、ピリダジニルオキシ、ピリミジニルオキシ、ピラジニルオキシまたはベンゾオキサゾリルオキシであり得、好適にはフリルオキシ、チエニルオキシ、ピロリルオキシ、イミダゾリルオキシ、チアゾリルオキシまたはピリジルオキシであり、更に好適にはピリジルオキシである。

【0030】Wが酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基を示す場合、当該基は、例えばフリルチオ、チエニルチオ、ピロリルチオ、アゼピニルチオ、ピラゾリルチオ、イミダゾリルチオ、オキサゾリルチオ、イソキサゾリルチオ、チアゾリルチオ、イソチアゾリルチオ、1,2,3-オキサジアゾリルチオ、トリアゾリルチオ、テトラゾリルチオ、チアジアゾリルチオ、ピラニルチオ、ピリジルチオ、ピリダジニルチオ、ピリミジニルチオ、ピラジニルチオまたはベンゾオキサゾイルチオであり得、好適にはフリルチオ、チエニルチオ、ピロリルチオ、イミダゾリルチオ、チアゾリルチオ、ピリジルチオまたはベンゾオキサゾイルチオであり、更に好適にはベンゾオキサゾイルチオである。

【0031】Wが酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環基を示す場合、当該基は、例えばモルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、ピラゾリジニル、ピラゾリニル、ピペリジル、ピペラジニルであり得、好適にはモルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、ピペリジルまたはピペラジニルである。

【0032】Wがアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基を示す場合、該モノアルキルアミノ基は、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノまたはイソブチルアミノであり得、好適には炭素数1ないし3個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基であり、更に好適にはプロピルアミノである。

【0033】Wが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリー

(29)

55

ルアミノ基の該アルキルは、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチルまたはt-ブチルであり得、好適にはメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチルまたはイソブチルであり、更に好適にはメチルまたはエチルである。該アリールは、例えばフェニルまたはナフチルであり得、好適にはフェニルである。無置換N-アルキル-N-アリールアミノ基の具体例は、例えばN-メチル-N-フェニルアミノ、N-エチル-N-フェニルアミノ、N-プロピル-N-フェニルアミノ、N-イソプロピル-N-フェニルアミノ、N-ブチル-N-フェニルアミノ、N-イソブチル-N-フェニルアミノまたはN-メチル-N-ナフチルアミノであり得、好適にはN-メチル-N-フェニルアミノまたはN-エチル-N-フェニルアミノであり、更に好適にはN-エチル-N-フェニルアミノである。置換N-アルキル-N-アリールアミノ基は、例えばN-メチル-N-(メチルフェニル)アミノ、N-エチル-N-(メチルフェニル)アミノ、N-メチル-N-(メトキシフェニル)アミノまたはN-エチル-N-(メトキシフェニル)アミノであり得、好適にはN-メチル-N-(メチルフェニル)アミノまたはN-エチル-N-(メチルフェニル)アミノである。

【0034】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールアミノ基を示す場合、無置換アリールアミノ基は、例えばフェニルアミノまたはナフチルアミノであり得、好適にはフェニルアミノである。置換アリールアミノ基は、例えば(メチルフェニル)アミノ、(エチルフェニル)アミノ、(プロピルフェニル)アミノ、(イソプロピルフェニル)アミノ、(メトキシフェニル)アミノ、(エトキシフェニル)アミノ、(メチルチオフェニル)アミノ、(エチルチオフェニル)アミノ、(ピフェニル)アミノまたは(メタンスルホンフェニル)アミノであり得、好適には(メチルフェニル)アミノ、(イソプロピルフェニル)アミノまたは(メトキシフェニル)アミノである。

【0035】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基を示す場合、無置換アラルキルアミノ基は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルアミノ基に上記で述べたアリール基が置換されている基であり、例えばベンジルアミノ、フェネチルアミノ、(3-フェニルプロピル)アミノ、(4-フェニルブチル)アミノ、(1-ナフチルメチル)アミノまたは(2-ナフチルメチル)アミノであり得、好適にはベンジルアミノまたはフェネチルアミノであり、更に好適にはベンジルアミノである。置換アラルキルアミノ基は、例えば(メチルベンジル)アミノ、(メトキシベンジル)アミノ、[2-(メチルフェニル)エチル]アミノ、[2-(メトキシフェニル)エチル]アミノ、[3-(メチルフェニル)プロピル]アミノ、[3-(メトキシフェニル)プロピル]アミノ、[4-(メチルフェニル)ブチル]アミノまたは[4-(メトキシフェニル)ブチル]アミノであり得、好適には(メチルベンジル)アミノまたは[2-(メチルフェニル)エチル]アミノである。

56

【0036】Wがアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラルキルを有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示す場合、当該基としては、例えばベンジルオキシカルボニルであり得る。

【0037】Wがアミノ基、アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリールアミノ基、アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールアミノ基、アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基またはアリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個のアラルキルを有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示す場合、好適にはアミノ基、アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルおよび1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールを有するN-アルキル-N-アリールアミノ基、アリール部分に1ないし5個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルアミノ基である。最適にはアセチル基である。Xが1な

【0038】R⁵が炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す場合、該アシル基は、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ベンゾイルまたはp-トルオイルであり得、好適には炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であり、更に好適には炭素数2ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基である。最適にはアセチル基である。Xが1な

【0039】R⁶が炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す場合、該アシル基は、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ベンゾイルまたはp-トルオイルであり得、好適には炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であり、更に好適には炭素数2ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基である。最適にはアセチル基である。Xが1な

(30)

57

いし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、無置換アリール基は、例えばフェニルまたはナフチルであり得、好適にはフェニルである。Xが1ないし3個の後述する置換分 α で置換されているアリール基を示す場合、該置換分の数是好適には1または2個であり、更に好適には1個である。

【0039】Xが、1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示す場合、無置換の複素芳香環基としては、1環系または2環系からなる。2環系からなる場合は、うち1環は少なくとも複素環である。2環系の場合は、縮合環であり、1環が複素環で他環が炭素環である場合または2環共複素環である場合がある。複素環は5または6員環であり、それらは窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する。炭素環は炭素数6ないし10個を有するアリール基である。1環系の場合を複素芳香単環基、2環系の場合を複素芳香縮合環基という。4個のヘテロ原子を有する環の場合、好ましくは4個がすべて窒素原子であり、酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子が0個の場合であり、3個のヘテロ原子を有する環の場合、好ましくは3個、2個または1個が窒素原子であり、1個または2個が酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子の場合であり、2個のヘテロ原子を有する環の場合、好ましくは2個、1個または0個が窒素原子であり、0個、1個または2個が酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子の場合である。Xが1ないし3個の後述する置換分 α で置換されている複素芳香環基を示す場合、該置換分の数是好適には1または2個であり、更に好適には1個である。

【0040】無置換複素芳香単環基は、例えば2-ピロリル、3-ピロリルのようなピロリル基；2-フリル、3-フリルのようなフリル基；2-チエニル、3-チエニルのようなチエニル基；2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジルのようなピリジル基；2-イミダゾリル、4-イミダゾリルのようなイミダゾリル基；3-ピラゾリル、4-ピラゾリルのようなピラゾリル基；2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリルのようなオキサゾリル基；3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリルのようなイソオキサゾリル基；2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリルのようなチアゾリル基；3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリルのようなイソチアゾリル基；1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イルのようなトリアゾリル基；1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルの

58

ようなチアジアゾリル基；1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イルのようなオキサジアゾリル基；5-テトラゾリルのようなテトラゾリル基；3-ピリダジニル、4-ピリダジニルのようなピリダジニル基；2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニルのようなピリミジニル基；ピラジニル基；1, 4-オキサジーン-2-イル、1, 4-オキサジーン-3-イルのようなオキサジニル基；1, 4-チアジーン-2-イル、1, 4-チアジーン-3-イルのようなチアジニル基；であり得、無置換複素芳香縮合環基は、例えばインドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イルのようなインドリル基；インダゾール-2-イル、インダゾール-3-イル、インダゾール-4-イル、インダゾール-5-イル、インダゾール-6-イル、インダゾール-7-イルのようなインダゾリル基；ベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-3-イル、ベンゾフラン-4-イル、ベンゾフラン-5-イル、ベンゾフラン-6-イル、ベンゾフラン-7-イルのようなベンゾフランリル基；ベンゾチオフエン-2-イル、ベンゾチオフエン-3-イル、ベンゾチオフエン-4-イル、ベンゾチオフエン-5-イル、ベンゾチオフエン-6-イル、ベンゾチオフエン-7-イルのようなベンゾチオフエニル基；ベンゾイミダゾール-2-イル、ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、ベンゾイミダゾール-6-イル、ベンゾイミダゾール-7-イルのようなベンゾイミダゾリル基；ベンゾオキサゾール-2-イル、ベンゾオキサゾール-4-イル、ベンゾオキサゾール-5-イル、ベンゾオキサゾール-6-イル、ベンゾオキサゾール-7-イルのようなベンゾオキサゾリル基；ベンゾチアゾール-2-イル、ベンゾチアゾール-4-イル、ベンゾチアゾール-5-イル、ベンゾチアゾール-6-イル、ベンゾチアゾール-7-イルのようなベンゾチアゾリル基；2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリルのようなキノリル基；1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、8-イソキノリルのようなイソキノリル基；1, 4-ベンゾオキサジーン-2-イル、1, 4-ベンゾオキサジーン-3-イルのようなベンゾオキサジニル基；1, 4-ベンゾチアジーン-2-イル、1, 4-ベンゾチアジーン-3-イルのようなベンゾチアジニル基；ピロロ〔2, 3-b〕ピリジ-2-イル、ピロロ〔2, 3-b〕ピリジ-3-イルのようなピロロ〔2, 3-b〕ピリジリル基；フロ〔2, 3-b〕ピリジ-2-イル、フロ〔2, 3-b〕ピリジ-3-イルのようなフロ〔2, 3-b〕ピリジリル基；チエノ〔2, 3-b〕ピリジ-2-イル、チエノ〔2, 3-b〕ピリジ-3-イルのようなチエノ〔2, 3-b〕ピリジリル基；1, 8-ナフチリジン-2-イル、1, 8-ナフチリジン-3-イル、1,

(31)

59

5-ナフチリジン-2-イル、1, 5-ナフチリジン-3-イルのようなナフチリジニル基；イミダゾ〔4, 5-b〕ピリジ-2-イル、イミダゾ〔4, 5-b〕ピリジ-5-イルのようなイミダゾピリジニル基；オキサゾロ〔4, 5-b〕ピリジ-2-イル、オキサゾロ〔5, 4-b〕ピリジ-2-イルのようなオキサゾロピリジニル基；およびチアゾロ〔4, 5-b〕ピリジ-2-イル、チアゾロ〔4, 5-c〕ピリジ-2-イルのようなチアゾロピリジニル基；であり得る。

【0041】複素芳香単環基は好適には、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし3個有する5員または6員環基であり、前記例示のピロリル基、フリル基、チエニル基、ピリジニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、トリアゾリル基、チアジアゾリル基、オキサジアゾリル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基またはピラジニル基である。複素芳香縮合環基は、好適には、ベンゼン環と前記窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし3個有する5員または6員の複素芳香単環との縮合環基であり、前記例示のインドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチオフェニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、キノリル基またはイソキノリル基である。更に好適には、イミダゾリル基、オキサゾリル基、ピリジニル基、インドリル基、キノリル基またはイソキノリル基であり、更により好適にはピリジニル基、インドリル基、キノリル基またはイソキノリル基である。最適にはピリジニル基、キノリル基またはイソキノリル基であり、特に最適にはピリジニル基である。

【0042】上記Xが炭素数6ないし10個を有するアリール基または酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示す場合、該アリール基および複素芳香環基は前述した如く、1ないし3個の置換分 α を有していてもよい。

【0043】置換分 α が炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、ハロゲン原子、同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基を示す場合、これらの基は前述のR³で示したと同様の基をあげることができる。ただし、置換分 α が炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示す場合、好適にはメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、 ι -ブチルであり、更に好適にはメチル、イソプロピルまたは ι -ブチルである。

【0044】置換分 α がアラルキル部分が炭素数7ない

60

し12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基を示す場合、当該基は、例えばベンジルオキシカルボニルアミノであり得る。置換分 α が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル基を示す場合、該ハロゲン化アルキル基は、例えばクロロメチル、ブロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチルまたはトリクロロメチルであり得、好適には1ないし3個のフッ素原子を有するフルオロメチルであり、更に好適にはトリフルオロメチルである。

【0045】置換分 α が炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ基を示す場合、該アシルオキシ基は、例えばホルミルオキシ、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、アクロイルオキシ、メタアクロイルオキシまたはクロトノイルオキシであり得、好適には炭素数1ないし4個を有するアルカノイルオキシ基であり、更に好適には炭素数1もしくは2個を有するアルカノイルオキシであり、最適にはアセトキシである。

【0046】置換分 α が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基を示す場合、該ハロゲン化アルコキシ基は、例えばクロロメトキシ、ブロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、トリクロロメトキシまたは2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシであり得、好適には炭素数1ないし3個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基であり、更に好適には、1ないし3個のフッ素原子を有するメトキシまたは2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシである。最適にはトリフルオロメトキシまたは2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ（特に、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ）である。

【0047】置換分 α が炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示す場合、該アシル基は、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、アクロイル、メタアクロイルまたはクロトノイルであり得、好適には炭素数2ないし3個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であり、更に好適にはアセチルである。

【0048】置換分 α が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ基を示す場合、該アルキレンジオキシ基は、例えばメチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、テトラメチレンジオキシまたはプロピレンジオキシであり得、好適にはメチレンジオキシまたはエチレンジオキシであり、更に好適にはメチレンジオキシである。

(32)

61

【0049】置換分 α が1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基を示す場合、該アラルキルオキシ基は、例えばベンジルオキシ、フェネチルオキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、1-ナフチルメトキシまたは2-ナフチルメトキシであり得、好適には無置換の炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ（例えばベンジルオキシ、2-フェネチルオキシ、1-ナフチルメトキシまたは2-ナフチルメトキシ）であり、更に好適にはベンジルオキシである。置換分 α が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル基を示す場合、該アルキルスルホニル基は、例えばメタンスルホニル、エタンスルホニル、プロパンスルホニル、イソプロパンスルホニル、ブタンスルホニル、イソブタンスルホニル、s-ブタンスルホニルまたはt-ブタンスルホニルであり得、好適にはメタンスルホニル、エタンスルホニルまたはイソプロパンスルホニルであり、特に好適には炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル（特にメタンスルホニル）である。

【0050】置換分 α がアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基を示す場合、当該基としては、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、s-ブチルアミノまたはt-ブチルアミノであり得、好適にはメチルアミノ、エチルアミノ、イソプロピルアミノまたはt-ブチルアミノであり、更に好適にはメチルアミノである。

【0051】置換分 α がアルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ基を示す場合、当該基としては、例えばメトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノまたはt-ブトキシカルボニルアミノであり、好適にはt-ブトキシカルボニルアミノである。

【0052】置換分 α がアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基を示す場合、例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1-ナフチルメトキシまたは2-ナフチルメトキシであり得、好適にはフェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいベンジルであり、更に好適にはベンジルである。

【0053】置換分 α が同一または異なって1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、該アリール基は、例えばフェニル、ナフチル、メチルフェニル、（トリフルオロメチル）フェニル、ヒドロキシフェニル、メトキシフェニル、エトキシフェニル、（トリフルオロメトキシ）フェニル、メチレンジオキシフェニル、（ヒド

62

ロキシメチル）フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ブロモフェニル、ニトロフェニル、ホルミルフェニル、シアノフェニル、カルボキシルフェニル、アミノフェニル、（ジメチルアミノ）フェニル、（アミノメチル）フェニル、（2-アミノエチル）フェニル、

〔（N，N-ジメチルアミノ）メチル〕フェニル、（t-ブトキシカルボニルアミノ）フェニル、（ベンジルオキシカルボニルアミノ）フェニルまたは4-ヒドロキシ-3，5-ジメチルフェニルであり得、好適には、1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいフェニル（特に、フェニル、メチルフェニル、（トリフルオロメチル）フェニル、ヒドロキシフェニル、メトキシフェニル、（トリフルオロメトキシ）フェニル、メチレンジオキシフェニル、（ヒドロキシメチル）フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ニトロフェニル、ホルミルフェニル、シアノフェニル、カルボキシルフェニル、ジメチルアミノフェニル、アミノメチルフェニル、（N，N-ジメチルアミノメチル）フェニルまたは4-ヒドロキシ-3，5-ジメチルフェニル）であり、更に好適には、フェニル、メチルフェニル、（トリフルオロメチル）フェニル、ヒドロキシフェニル、メトキシフェニル、（トリフルオロメトキシ）フェニル、メチレンジオキシフェニル、（ヒドロキシメチル）フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ニトロフェニル、ホルミルフェニル、シアノフェニル、カルボキシルフェニル、（ジメチルアミノ）フェニル、（アミノメチル）フェニル、（N，N-ジメチルアミノメチル）フェニルまたは4-ヒドロキシ-3，5-ジメトキシフェニルである。最適には、フェニル、（トリフルオロメチル）フェニル、メトキシフェニル、（ヒドロキシメチル）フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、クロロフェニル、ニトロフェニル、ホルミルフェニル、カルボキシルフェニル、ジメチルアミノフェニル、（N，N-ジメチルアミノメチル）フェニルまたは4-ヒドロキシ-3，5-ジメチルフェニルであり、特に最適にはフェニル、（トリフルオロメトキシ）フェニル、メトキシフェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、ホルミルフェニル、カルボキシルフェニルまたは（ジメチルアミノ）フェニルである。

【0054】置換分 α がアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基を示す場合、該アリールオキシ基は、例えばフェノキシ、ナフトキシ、メチルフェノキシ、（トリフルオロメチル）フェノキシ、メトキシフェノキシ、エトキシフェノキシ、フルオロフェノキシ、クロロフェノキシ、ブロムフェノキシまたはメチレンジオキシフェノキシであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいフェノキシ（特にフェノキシ）である。

(33)

63

【0055】置換分 α がアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基を示す場合、該アリールチオ基は、例えばフェニルチオ、メチルフェニルチオ、

(トリフルオロメチル)フェニルチオ、メトキシフェニルチオ、エトキシフェニルチオ、クロロフェニルチオ、ブROMフェニルチオ、メチレンジオキシフェニルチオまたはナフチルチオであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいフェニルチオ（特にフェニルチオ）である。

【0056】置換分 α がアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル基を示す場合、該アリールスルホニル基は、例えばフェニルスルホニル、メチルフェニルスルホニル、(トリフルオロメチル)フェニルスルホニル、メトキシフェニルスルホニル、エトキシフェニルスルホニル、クロロフェニルスルホニル、ブROMフェニルスルホニル、メチレンジオキシフェニルスルホニルまたはナフチルスルホニルであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいフェニルスルホニルである。

【0057】置換分 α がアリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ基（該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。）を示す場合、窒素原子の置換部分の該アルキルは前述したものと同意義を示す。該アリールスルホニルアミノ基は、例えば、(フェニルスルホニル)アミノ、(メチルフェニルスルホニル)アミノ、(トリフルオロメチルフェニルスルホニル)アミノ、(メトキシフェニルスルホニル)アミノ、(エトキシフェニルスルホニル)アミノ、クロロフェニルスルホニルアミノ、ブROMフェニルスルホニルアミノ、メチレンジオキシフェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、(ナフチルスルホニル)アミノまたはN-メチルナフチルスルホニルアミノであり得、好適にはフェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい（フェニルスルホニル）アミノまたはN-メチルフェニルスルホニルアミノ（特にフェニルスルホニルアミノまたはN-メチルフェニルスルホニルアミノ）である。

【0058】置換分 α が1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示す場合、無置換該基としては、例えばフリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、キノリル、イソキノリル、インドリルまたはピリジルであり得、好適にはイミダゾリル、キノリルまたはピリジルであり、特に好適にはピリジルで

64

ある。置換基を有する該基としては、メチルピリジル、(トリフルオロメチル)ピリジル、ヒドロキシピリジル、メトキシピリジル、エトキシピリジル、(トリフルオロメトキシ)ピリジル、(ヒドロキシメチル)ピリジル、フルオロピリジル、クロロピリジル、プロモピリジル、ニトロピリジル、ホルミルピリジル、シアノピリジル、カルボキシルピリジル、アミノピリジル、(ジメチルアミノ)ピリジル、(アミノメチル)ピリジル、

(2-アミノエチル)ピリジル、(N, N-ジメチルアミノメチル)ピリジル、(t-ブトキシカルボニルアミノ)ピリジルまたは(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ピリジルであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいピリジル（例えばメチルピリジル、(トリフルオロメチル)ピリジル、ヒドロキシピリジル、メトキシピリジル、(トリフルオロメトキシ)ピリジル、フルオロピリジル、クロロピリジル、ニトロピリジル、ホルミルピリジル、シアノピリジル、カルボキシルピリジル、アミノピリジル、ジメチルアミノピリジルまたは(N, N-ジメチルアミノメチル)ピリジル）またはイミダゾリル（環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。特にN-メチルイミダゾリル）であり、更に好適には、(トリフルオロメチル)ピリジル、メトキシピリジル、フルオロピリジル、クロロピリジル、ニトロピリジル、シアノピリジル、アミノピリジルまたはジメチルアミノピリジルである。

【0059】置換分 α が1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基を示す場合、該複素芳香環オキシ基としては、例えばフリルオキシ、チエニルオキシ、オキサゾリルオキシ、イソオキサゾリルオキシ、チアゾリルオキシ、イミダゾリルオキシ、キノリルオキシ、イソキノリルオキシ、インドリルオキシまたはピリジルオキシであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいピリジルオキシであり、特に好適にはピリジルオキシである。

【0060】置換分 α が1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基を示す場合、該複素芳香環チオ基は、例えばフリルチオ、チエニルチオ、オキサゾリルチオ、イソオキサゾリルチオ、チアゾリルチオ、イミダゾリルチオ、キノリルチオ、イソキノリルチオ、インドリルチオまたはピリジルチオであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいピリジルチオであり、特に好適にはピリジルチオである。

【0061】置換分 α が1ないし3個の後述する置換分

(34)

65

β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル基を示す場合、該複素芳香環スルホニル基は、例えばフリルスルホニル、チエニルスルホニル、オキサゾリルスルホニル、イソオキサゾリルスルホニル、チアゾリルスルホニル、イミダゾリルスルホニル、キノリルスルホニル、イソキノリルスルホニル、インドリルスルホニルまたはピリジンスルホニルであり得、好適には1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいピリジルスルホニルであり、特に好適にはピリジルスルホニルである。

【0062】置換分 α が複素芳香環部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニルアミノ（該アミノ部分は窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。）を示す場合、該複素芳香環スルホニルアミノ基は、例えばフリルスルホニルアミノ、チエニルスルホニルアミノ、オキサゾリルスルホニルアミノ、イソオキサゾリルスルホニルアミノ、チアゾリルスルホニルアミノ、イミダゾリルスルホニルアミノ、N-メチルイミダゾリルスルホニルアミノ、キノリルスルホニルアミノ、イソキノリルスルホニルアミノ、インドリルスルホニルアミノ、ピリジルスルホニルアミノまたはN-メチルピリジルスルホニルアミノであり得、好適にはピリジル部分に1ないし3個の後述する置換分 β を有していてもよいピリジルスルホニルアミノ（該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい）であり、特に好適にはピリジンスルホニルアミノまたはN-メチルピリジンスルホニルアミノである。

【0063】置換分 α が酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環基を示す場合、当該基としては、例えばモルホリル、チオモルホリル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、ピラゾリジニル、ピラゾリニル、ピペリジルまたはピペラジニルであり得、好適にはモルホリル、チオモルホリル、ピロリジニル、ピペリジルまたはピペラジニル（特にピペリジル）である。

【0064】ここに、置換分 β が炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子または同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基を示す場合、これらの基は前

66

述の R^3 で示したと同様の基をあげることができる。

【0065】置換分 β が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ基、炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコシカルボニルアミノ基またはアラルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ基、を示す場合、これらの基は前述の α で示したと同様の基をあげることができる。

【0066】置換分 β が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル基を示す場合、当該基としては、例えばヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピルまたは4-ヒドロキシブチルであり得、好適にはヒドロキシメチルである。

【0067】置換分 β が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル基を示す場合、当該基としては、例えばアミノメチル、2-アミノエチル、3-アミノプロピルまたは4-アミノブチルであり得、好適にはアミノメチルまたは2-アミノエチルであり、更に好適にはアミノメチルである。

【0068】置換分 β がモノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル基を示す場合、当該基としては、例えば、N-メチルアミノメチル、N-エチルアミノメチル、N-メチルアミノエチル、N-エチルアミノエチル、N-メチルアミノプロピルまたはN-メチルアミノブチルであり得、好適にはN-メチルアミノメチルまたはN-メチルアミノエチルである。

【0069】置換分 β がジアルキルアミノ部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるジアルキルアミノアルキル基を示す場合、当該基としては、例えば、N, N-ジメチルアミノメチル、N, N-ジエチルアミノメチル、N, N-ジメチルアミノエチル、N, N-ジエチルアミノエチル、N, N-ジメチルアミノプロピルまたはN, N-ジメチルアミノブチルであり得、好適にはN, N-ジメチルアミノメチルまたはN, N-ジメチルアミノエチルであり、更に好適にはN, N-ジメチルアミノメチルである。

【0070】従って、Xが置換もしくは無置換の炭素数6ないし10個を有するアリール基または置換もしくは

(35)

67

無置換の酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる環から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基を示す場合、これらの好適な具体例は、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、m-トリル基、p-トリル基、3-エチルフェニル基、4-エチルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、3-t-ブチルフェニル基、4-t-ブチルフェニル基、4-クロロメチルフェニル基、4-ブロモメチルフェニル基、4-フルオロメチルフェニル基、4-ヨードメチルフェニル基、3-ジフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-トリクロロメチルフェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、3-アセトキシフェニル基、4-アセトキシフェニル基、5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-3, 4, 6-トリメチルフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-エトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、フェネチルオキシフェニル基、1-ナフチルメトキシフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、3-エチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニル基、3-イソプロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、3-エタンスルホニルフェニル基、4-エタンスルホニルフェニル基、3-イソプロパンスルホニルフェニル基、4-イソプロパンスルホニルフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-アミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、3-プロピルアミノフェニル基、4-ブチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、3-ジプロピルアミノフェニル基、4-ジブチルアミノフェニル基、3-ベンジルフェニル基、4-ベンジルフェニル基、3-フェネチルフェニル基、4-(1-ナフチルメチル)フェニル基、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基、3-(4-メチルフェニル)フェニル基、4-(4-メチルフェニル)フェニル基、3-(4-エチルフェニル)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)フェニル基、4-(2-ヒドロキシフェニル)フェニル、4-(3-ヒドロキシフェニル)フェニル、4-(4-ヒドロキシフェニル)フェニル、4-(4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル)フェニル、3-(4-メトキシフェニル)フェニル基、4-(2-メトキシフェ

68

ニル)フェニル基、4-(3-メトキシフェニル)フェニル基、4-(4-メトキシフェニル)フェニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)フェニル基、4-(2, 4-ジメトキシフェニル)フェニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェニル)フェニル基、4-(2, 5-ジメトキシフェニル)フェニル基、4-(3-ヒドロキシメチルフェニル)フェニル、4-(4-ヒドロキシメチルフェニル)フェニル、4-(3-フルオロフェニル)フェニル、4-(4-フルオロフェニル)フェニル、4-(3-クロロフェニル)フェニル基、4-(4-クロロフェニル)フェニル基、4-(3-ブロモフェニル)フェニル基、4-(4-ブロモフェニル)フェニル基、3-(3, 4-メチレンジオキシフェニル)フェニル基、4-(3, 4-メチレンジオキシフェニル)フェニル基、4-(2-ホルミルフェニル)フェニル、4-(3-ホルミルフェニル)フェニル、4-(4-ホルミルフェニル)フェニル、4-(3-カルボキシルフェニル)フェニル、4-(4-カルボキシルフェニル)フェニル、4-(3-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル)フェニル、4-(4-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル)フェニル、3-ベンジルフェニル基、4-ベンジルフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、3-フェニルチオフェニル基、4-フェニルチオフェニル基、3-フェニルスルホニルフェニル基、4-フェニルスルホニルフェニル基、3-(フェニルスルホニルアミノ)フェニル基、4-(フェニルスルホニルアミノ)フェニル基、3-(N-メチルフェニルスルホニルアミノ)フェニル基、4-(N-メチルフェニルスルホニルアミノ)フェニル基、3-(イミダゾール-1-イル)フェニル基、4-(イミダゾール-1-イル)フェニル基、3-(1-メチルイミダゾール-4-イル)フェニル基、4-(1-メチルイミダゾール-4-イル)フェニル基、3-(2-フリル)フェニル基、4-(2-フリル)フェニル基、3-(2-チエニル)フェニル基、4-(2-チエニル)フェニル基、3-(3-チエニル)フェニル基、4-(3-チエニル)フェニル基、3-(2-ピリジル)フェニル基、4-(2-ピリジル)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルピリジン-5-イル)フェニル基、4-(2-メトキシピリジン-5-イル)フェニル基、4-(2-ニトロピリジン-5-イル)フェニル基、4-(2-N, N-ジメチルアミノピリジン-5-イル)フェニル基、3-(3-ピリジル)フェニル基、4-(3-ピリジル)フェニル基、3-(4-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリジル)フェニル基、4-(イミダゾール-1-イルチオ)フェニル基、4-(2-フリルチオ)フェニル基、4-(2-チエニルチオ)フェニル基、4-(2-ピリジルチオ)フェニル基、4-(4-ピリジルチオ)フェニル基、3-(2-ピリジルスルホニル)フェニル基、4-(2-ピリジ

(36)

69

スルホニル) フェニル基、3-(3-ピリジルスルホニル) フェニル基、4-(3-ピリジルスルホニル) フェニル基、3-(2-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、3-(N-メチル-2-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、4-(2-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、4-(N-メチル-2-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、3-(3-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、3-(N-メチル-3-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、4-(3-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、4-(N-メチル-3-ピリジルスルホニルアミノ) フェニル基、3-(オキサゾール-2-イル) フェニル基、4-(オキサゾール-2-イル) フェニル基、3-(オキサゾール-4-イル) フェニル基、4-(オキサゾール-4-イル) フェニル基、3-(オキサゾール-5-イル) フェニル基、4-(オキサゾール-5-イル) フェニル基、3-(チアゾール-2-イル) フェニル基、4-(チアゾール-2-イル) フェニル基、3-(チアゾール-4-イル) フェニル基、4-(チアゾール-4-イル) フェニル基、3-(チアゾール-5-イル) フェニル基、4-(チアゾール-5-イル) フェニル基、4-(ピペリジン-1-イル) フェニル、1-メチル-2-ピロリル基、1-フェニル-2-ピロリル基、1-ベンジル-2-ピロリル基、5-メチル-2-フリル基、5-フェニル-2-フリル基、5-メチル-2-チエニル基、5-フェニル-2-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、5-フェニル-3-チエニル基、1-メチル-3-ピラゾリル基、1-フェニル-3-ピラゾリル基、3-イミダゾリル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、1-フェニル-2-イミダゾリル基、1-メチル-4-イミダゾリル基、1-フェニル-4-イミダゾリル基、1-メチル-2-フェニル-4-イミダゾリル基、1、5-ジメチル-2-フェニル-4-イミダゾリル基、1、4-ジメチル-2-フェニル-5-イミダゾリル基、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基、2-メチル-4-オキサゾリル基、2-フェニル-4-オキサゾリル基、2-メチル-5-オキサゾリル基、2-フェニル-5-オキサゾリル基、4-メチル-2-フェニル-5-オキサゾリル基、5-メチル-2-フェニル-4-オキサゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-メチル-4-チアゾリル基、2-フェニル-4-チアゾリル基、2-メチル-5-チアゾリル基、2-フェニル-5-チアゾリル基、4-メチル-2-フェニル-5-チアゾリル基、5-メチル-2-フェニル-4-チアゾリル基、1-メチル-3-ピラゾリル基、1-フェニル-3-ピラゾリル基、3-メチル-5-イソオキサゾリル基、3-フェニル-5-イソオキサゾリル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-メチル-5-ピリジル基、3-エチル-5-ピリジル基、3-フェニル-5-ピリジル基、2-メチル-5-ピリ

70

ジル基、2-エチル-5-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリジル基、2-(4-メトキシフェニル)-5-ピリジル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-ピリジル基、2-ヒドロキシ-5-ピリジル基、2-メトキシ-5-ピリジル基、2-エトキシ-5-ピリジル基、2-イソプロポキシ-5-ピリジル基、2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシフェニル)-5-ピリジル、2-ベンジルオキシ-5-ピリジル基、2-メチルチオ-5-ピリジル基、2-エチルチオ-5-ピリジル基、2-イソプロピルチオ-5-ピリジル基、2-メタンスルホニル-5-ピリジル基、2-エタンスルホニル-5-ピリジル基、2-イソプロパンスルホニル-5-ピリジル基、2-ベンジル-5-ピリジル基、2-フェノキシ-5-ピリジル基、2-フェニルチオ-5-ピリジル基、2-フェニルスルホニル-5-ピリジル基、2-フェニルスルホニルアミノ-5-ピリジル基、2-(N-メチルフェニルスルホニルアミノ)-5-ピリジル基、3-メチル-6-ピリジル基、3-フェニル-6-ピリジル基、2-メチル-6-ピリジル基、2-フェニル-6-ピリジル基、2-メチル-4-ピリミジニル基、2-フェニル-4-ピリミジニル基、2-メトキシ-4-ピリミジニル基、2-エトキシ-4-ピリミジニル基、2-イソプロポキシ-4-ピリミジニル基、2-メチルチオ-4-ピリミジニル基、2-エチルチオ-4-ピリミジニル基、2-イソプロピルチオ-4-ピリミジニル基、2-フェニルチオ-4-ピリミジニル基、2-メタンスルホニル-4-ピリミジニル基、2-エタンスルホニル-4-ピリミジニル基、2-イソプロピルスルホニル-4-ピリミジニル基、2-フェニルスルホニル-4-ピリミジニル基、2-メチル-5-ピリミジニル基、2-フェニル-5-ピリミジニル基、2-メトキシ-5-ピリミジニル基、2-エトキシ-5-ピリミジニル基、2-イソプロポキシ-5-ピリミジニル基、2-メチルチオ-5-ピリミジニル基、2-エチルチオ-5-ピリミジニル基、2-イソプロピルチオ-5-ピリミジニル基、2-フェニルチオ-5-ピリミジニル基、2-メタンスルホニル-5-ピリミジニル基、2-エタンスルホニル-5-ピリミジニル基、2-イソプロピルスルホニル-5-ピリミジニル基、2-フェニルスルホニル-5-ピリミジニル基、2-インドリル基、3-インドリル基、1-メチル-2-インドリル基、1-メチル-3-インドリル基、2-ベンズイミダゾリル基、1-メチル-2-ベンズイミダゾリル基、2-ベンズオキサゾリル基、2-ベンズチアゾリル基、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、1-イソキノリル基、3-イソキノリル基、4-イソキノリル基または8-イソキノリル基であり、好適にはフェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、m-トリル基、p-トリル基、3-エチルフェニル基、4-エチルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピル

(37)

71

エニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-ヒ
 ドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-
 ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル基、3-アセト
 キシフェニル基、4-アセトキシフェニル基、5-アセ
 トキシ-2-ヒドロキシ-3, 4, 6-トリメチルフェ
 ニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェ
 ニル基、3-エトキシフェニル基、4-エトキシフェ
 ニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポ
 キシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、
 ベンジルオキシフェニル基、3-メチルチオフェニル
 基、4-メチルチオフェニル基、3-エチルチオフェ
 ニル基、4-エチルチオフェニル基、3-メタンスルホ
 ニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、3-
 エタンスルホニルフェニル基、4-エタンスルホニル
 フェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェ
 ニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル
 基、4-ジエチルアミノフェニル、3-ベンジルフェ
 ニル基、4-ベンジルフェニル基、3-ビフェニル基、
 4-ビフェニル基、3-(4-メチルフェニル)フェ
 ニル基、4-(4-メチルフェニル)フェニル基、3-
 (4-エチルフェニル)フェニル基、3-(4-トリフ
 ルオロメチルフェニル)フェニル基、4-(4-トリフ
 ルオロメチルフェニル)フェニル基、4-(2-ヒド
 ロキシフェニル)フェニル、4-(3-ヒドロキシフェ
 ニル)フェニル、4-(4-ヒドロキシフェニル)フェ
 ニル、4-(4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェ
 ニル)フェニル、3-(4-メトキシフェニル)フェ
 ニル基、4-(2-メトキシフェニル)フェニル基、4-
 (3-メトキシフェニル)フェニル基、4-(4-メ
 トキシフェニル)フェニル基、3-(2, 4-ジメトキシ
 フェニル)フェニル基、4-(2, 4-ジメトキシフェ
 ニル)フェニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェ
 ニル)フェニル基、4-(2, 5-ジメトキシフェ
 ニル)フェニル基、4-(3-ヒドロキシメチルフェ
 ニル)フェニル基、4-(4-ヒドロキシメチルフェ
 ニル)フェニル基、4-(3-フルオロフェニル)フェ
 ニル基、4-(4-フルオロフェニル)フェニル基、4-
 (3-クロロフェニル)フェニル基、4-(4-クロロフェ
 ニル)フェニル基、3-(3, 4-メチレンジオキシフェ
 ニル)フェニル基、4-(3, 4-メチレンジオキシフ
 エニル)フェニル基、2-ホルミルフェニル基、3-ホル
 ミルフェニル基、4-ホルミルフェニル基、3-カル
 ボキシルフェニル基、4-カルボキシル、3-N, N-
 ジメチルアミノメチルフェニル基、4-N, N-ジメ
 チルアミノメチルフェニル基、3-フェノキシフェ
 ニル基、4-フェノキシフェニル基、3-フェニルチオ
 フェニル基、4-フェニルチオフェニル基、3-フェ
 ニルスルホニルフェニル基、4-フェニルスルホ
 ニルフェニル基、3-(フェニルスルホニルアミ
 ノ)フェニル基、4-(フェニルスルホニルアミ
 ノ)フェニル基、3-(N

72

-メチルフェニルスルホニルアミノ)フェニル基、4-
 (N-メチルフェニルスルホニルアミノ)フェニル基、
 3-(2-ピリジル)フェニル基、4-(2-ピリジ
 ル)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルピリジ
 ン-5-イル)フェニル基、4-(2-メトキシピリジ
 ン-5-イル)フェニル基、4-(2-ニトロピリジ
 ン-5-イル)フェニル基、4-(2-N, N-ジメチル
 アミノピリジン-5-イル)フェニル基、3-(3-ピ
 リジル)フェニル基、4-(3-ピリジル)フェニル
 基、3-(4-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリ
 ジル)フェニル基、4-(2-ピリジルオキシ)フェ
 ニル基、4-(4-ピリジルオキシ)フェニル基、4-
 (2-ピリジルチオ)フェニル基、4-(4-ピリジ
 ルチオ)フェニル基、3-(2-ピリジルスルホニル)
 フェニル基、4-(2-ピリジルスルホニル)フェ
 ニル基、3-(3-ピリジルスルホニル)フェニル基、4-
 (3-ピリジルスルホニル)フェニル基、3-(2-ピ
 リジルスルホニルアミノ)フェニル基、3-(N-メ
 チル-2-ピリジルスルホニルアミノ)フェニル基、4-
 (2-ピリジルスルホニルアミノ)フェニル基、4-
 (N-メチル-2-ピリジルスルホニルアミノ)フェ
 ニル基、3-(3-ピリジルスルホニルアミノ)フェ
 ニル基、3-(N-メチル-3-ピリジルスルホニルア
 ミノ)フェニル基、4-(3-ピリジルスルホニルア
 ミノ)フェニル基、4-(N-メチル-3-ピリジルス
 ルホニルアミノ)フェニル基、4-(1-ピペリジ
 ニル)フェニル基、3-イミダゾリル基、2-ピリ
 ジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-メ
 チル-5-ピリジル基、3-フェニル-5-ピリ
 ジル基、2-メチル-5-ピリジル基、2-エ
 チル-5-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリ
 ジル基、2-ヒドロキシ-5-ピリジル基、2-メ
 トキシ-5-ピリジル基、2-エトキシ-5-ピリ
 ジル基、2-イソプロポキシ-5-ピリジル基、2-
 (2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)-5-ピ
 リジル基、2-ベンジルオキシ-5-ピリジル基、
 2-メチルチオ-5-ピリジル基、2-エチルチ
 オ-5-ピリジル基、2-イソプロピルチオ-5-
 ピリジル基、2-メタンスルホニル-5-ピリ
 ジル基、2-エタンスルホニル-5-ピリジ
 ル基、2-イソプロパンスルホニル-5-ピリ
 ジル基、2-ベンジル-5-ピリジル基、2-フェ
 ノキシ-5-ピリジル基、2-フェニルチオ-5-
 ピリジル基、2-フェニルスルホニル-5-ピ
 リジル基、2-フェニルスルホニルアミノ-5-
 ピリジル基、2-(N-メチルフェニルスルホ
 ニルアミノ)-5-ピリジル基、2-(4-メトキシ
 フェニル)-5-ピリジル基、2-(4-フルオロ
 フェニル)-5-ピリジル基、3-メチル-6-
 ピリジル基、3-フェニル-6-ピリジル基、
 2-メチル-6-ピリジル基、2-フェニル-6-
 ピリジル基、2-キノリル基、3-キノリル基、
 4-キノリ

(38)

73

ル基、1-イソキノリル基、3-イソキノリル基、4-イソキノリル基または8-イソキノリル基であり、更に好適にはフェニル基、m-トリル基、p-トリル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル基、3-アセトキシフェニル基、4-アセトキシフェニル基、5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-3, 4, 6-トリメチルフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-ベンジルフェニル基、4-ベンジルフェニル基、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基、4-
 (4-トリフルオロメチルフェニル) フェニル基、4-
 (2-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (3-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (4-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (2-メトキシフェニル) フェニル基、4- (3-メトキシフェニル) フェニル基、4- (4-メトキシフェニル) フェニル基、4-
 (4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル) フェニル基、4- (4-フルオロフェニル) フェニル基、4- (4-クロロフェニル) フェニル基、4- (2-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (3-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (4-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (3-カルボキシルフェニル) フェニル基、4- (4-カルボキシルフェニル) フェニル基、4- (3-ヒドロキシメチルフェニル) フェニル基、4- (4-ヒドロキシメチルフェニル) フェニル基、4- (3-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル) フェニル基、4- (4-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル) フェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、3-フェニルチオフェニル基、4-フェニルチオフェニル基、3-フェニルスルホニルフェニル基、4-フェニルスルホニルフェニル基、3- (フェニルスルホニルアミノ) フェニル基、4- (フェニルスルホニルアミノ) フェニル基、3- (N-メチルフェニルスルホニルアミノ) フェニル基、4- (N-メチルフェニルスルホニルアミノ) フェニル基、3- (2-ピリジル) フェニル基、4- (2-ピリジル) フェニル基、4- (3-トリフルオロメチルピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-メトキシピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-ニトロピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-N, N-ジメチルアミノピリジン-6-イル) フェニル基、3- (3-ピリジル) フェニル基、4- (3-ピリジル) フェニル基、3- (4-ピリジル) フェニル基、4- (4-ピリジル) フェニル基、4- (2-ピリジールオキシ) フェニル基、4- (4-ピリジールオキシ) フェニル基、4- (2-ピリジールチオ) フェニル基、4- (4-ピリジールチオ) フェニル基、3- (2-ピリジールスルホニル) フェニル基、4- (2-ピリジールスルホニル) フェニル基、3- (3-ピリジールスルホニル) フェニル基、4- (3-ピリジールスルホニル) フェニル基、3- (2-ピリジールスルホ

74

ニルアミノ) フェニル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-メトキシ-5-ピリジル基、2-エトキシ-5-ピリジル基、2-イソプロポキシ-5-ピリジル基、2- (2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) -5-ピリジル基、2-ベンジルオキシ-5-ピリジル基、2-メチルチオ-5-ピリジル基、2-エチルチオ-5-ピリジル基、2-メタンスルホニル-5-ピリジル基、2-エタンスルホニル-5-ピリジル基、2-ベンジル-5-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリジル基、2- (4-メトキシフェニル) -5-ピリジル基、2- (4-フルオロフェニル) -5-ピリジル基、3-フェニル-5-ピリジル基、2-フェニル-6-ピリジル基、3-フェニル-6-ピリジル基、2-フェノキシ-5-ピリジル基、2-フェニルチオ-5-ピリジル基、2-フェニルスルホニル-5-ピリジル基、2-フェニルスルホニルアミノ-5-ピリジル基、2- (N-メチルフェニルスルホニルアミノ) -5-ピリジル基、2-メチル-5-ピリジル基、3-キノリル基、3-メチル-5-ピリジル基、3-キノリル基または3-インドリル基であり、特に好適にはフェニル基、p-トリル基、4-フルオロフェニル基、4-ベンジルフェニル基、4-ビフェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) フェニル基、4- (2-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (3-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (4-ヒドロキシフェニル) フェニル基、4- (2-メトキシフェニル) フェニル基、4- (3-メトキシフェニル) フェニル基、4- (4-メトキシフェニル) フェニル基、4- (4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル) フェニル基、4- (4-フルオロフェニル) フェニル基、4- (4-クロロフェニル) フェニル基、4- (2-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (3-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (4-ホルミルフェニル) フェニル基、4- (3-カルボキシルフェニル) フェニル基、4- (4-カルボキシルフェニル) フェニル基、4- (3-ヒドロキシメチルフェニル) フェニル基、4- (4-ヒドロキシメチルフェニル) フェニル基、4- (3-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル) フェニル基、4- (4-N, N-ジメチルアミノメチルフェニル) フェニル基、4-フェノキシフェニル基、4-フェニルチオフェニル基、4-フェニルスルホニルフェニル基、4- (フェニルスルホニルアミノ) フェニル基、4- (2-ピリジル) フェニル基、4- (3-トリフルオロメチルピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-メトキシピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-ニトロピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-N, N-ジメチルアミノピリジン-6-イル) フェニル基、4- (3-ピリジル) フェニル基、4- (4-ピリジル) フェニル基、4- (2-ピリジールオキシ) フェニル基、4- (4-ピリジールオキシ) フェニル基、4- (2-ピリジールチオ) フェニル基、4- (4-ピリジールチオ) フェニル基、3- (2-ピリジールスルホニル) フェニル基、4- (2-ピリジールスルホニル) フェニル基、3- (3-ピリジールスルホニル) フェニル基、4- (3-ピリジールスルホニル) フェニル基、3- (2-ピリジールスルホ

(39)

75

ーピリジル基、2-イソプロポキシ-5-ピリジル基、
2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)-
5-ピリジル基、2-ベンジルオキシ-5-ピリジ
ル基、2-メチルチオ-5-ピリジル基、2-エチルチ
オ-5-ピリジル基、2-メタンスルホニル-5-ピリジ
ル基、2-エタンスルホニル-5-ピリジル基、2-ベ
ンジル-5-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリジ
ル基、3-フェニル-5-ピリジル基、3-フェニル-6
-ピリジル基、2-(4-メトキシフェニル)-5-ピ
リジル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-ピリジ
ル基、2-フェニル-6-ピリジル基、2-フェノキシ
-5-ピリジル基、2-フェニルチオ-5-ピリジ
ル基、2-フェニルスルホニル-5-ピリジル基、2-フ
ェニルスルホニルアミノ-5-ピリジル基、2-(N-
メチルフェニルスルホニルアミノ)-5-ピリジル基、
2-メチル-5-ピリジル基または3-メチル-5-ピ
リジル基である。

【0071】Yが式 $>N-R^5$ を有する基(式中、 R^5
5 は水素原子、炭素数1ないし6個を有する直鎖状も
しくは分枝鎖状のアルキル基(R^3 で述べたと同意義を示
す。)または炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしく
は分枝鎖状の脂肪族アシル基(炭素数1ないし8個を有
するアルカノイル基および炭素数3ないし8個を有する
アルケノイル基を含む)または炭素数7ないし11個を
有する芳香族アシル基を示す。)を示す場合、式 $>N-
R^5$ を有する基は、例えばイミノ、メチルイミノ、エチ
ルイミノ、プロピルイミノ、イソプロピルイミノ、ブチ
ルイミノ、イソブチルイミノ、s-ブチルイミノ、t-
ブチルイミノ、ペンチルイミノ、1-メチルブチルイミ
ノ、2-メチルブチルイミノ、3-メチルブチルイミ
ノ、1, 1-ジメチルプロピルイミノ、1, 2-ジメチ
ルプロピルイミノ、2, 2-ジメチルプロピルイミノ、
1-エチルプロピルイミノ、ヘキシルイミノ、1-メチ
ルペンチルイミノ、2-メチルペンチルイミノ、3-メ
チルペンチルイミノ、4-メチルペンチルイミノ、1,
1-ジメチルブチルイミノ、1, 2-ジメチルブチルイ
ミノ、1, 3-ジメチルブチルイミノ、2, 2-ジメチ
ルブチルイミノ、2, 3-ジメチルブチルイミノ、3,
3-ジメチルブチルイミノ、1-エチルブチルイミノ、
1, 1, 2-トリメチルプロピルイミノ、1, 2, 2-
トリメチルプロピルイミノ、アセチルイミノ、プロピ
オニルイミノ、ブチルイミノ、ペンタノイルイミノ、ヘ
キサノイルイミノ、ヘプタノイルイミノ、オクタノイ
ルイミノ、ベンゾイルイミノまたはp-トルオイルイミ
ノであり得、好適にはイミノ基、炭素数1ないし4個を有
する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルイミノ基または
アセチルイミノ基であり、最適にはイミノ基、メチルイ
ミノ基、エチルイミノ基またはアセチルイミノ基であ
る。

【0072】本発明の前記一般式(I)を有するアミド

76

カルボン酸誘導体は、常法に従って塩基性基を有する場
合は酸付加塩にすることができる。そのような塩は、例
えばフッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸のよ
うなハロゲン化水素酸の塩；硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸
塩、燐酸塩のような無機酸塩；メタンスルホン酸、トリ
フルオロメタンスルホン酸、エタンスルホン酸のような
低級アルカンスルホン酸の塩；ベンゼンスルホン酸、p
-トルエンスルホン酸のようなアリールスルホン酸の
塩；グルタミン酸、アスパラギン酸のようなアミノ酸の
塩；酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リ
ンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビ
ン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸のようなカルボン酸
の塩をあげることができる。好適にはハロゲン化水素酸
の塩である。

【0073】更に、前記一般式(I)を有するアミドカ
ルボン酸誘導体は、カルボキシル基を有するので常法に
従って金属塩にすることができる。そのような塩として
は、例えばリチウム、ナトリウム、カリウムのようなアル
カリ金属塩；カルシウム、バリウム、マグネシウムの中
のようなアルカリ土類金属塩；アルミニウム塩；等をあげ
ることができる。好適にはアルカリ金属塩である。

【0074】本発明の前記一般式(I)を有するアミド
カルボン酸誘導体は、常法に従って薬理上許容されるエ
ステルにすることができる。前記一般式(I)を有する
アミドカルボン酸誘導体の薬理上許容されるエステル
は、前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体
に比べて医学的に使用され、薬理上受け入れられるもの
であれば特に限定はない。

【0075】本発明の前記一般式(I)を有するアミド
カルボン酸誘導体のエステルは、例えば炭素数1ないし
6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭
素数7ないし19個を有するアラルキル基、炭素数1ない
し6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルカノイ
ルオキシが置換した炭素数1ないし5個を有する直鎖状
もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし6個を
有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルオキシカルボ
ニルオキシが置換した炭素数1ないし5個を有する直鎖
状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数5ないし7個
を有するシクロアルキルカルボニルオキシが置換した炭
素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアル
キル基、炭素数5ないし7個を有するシクロアルキル
オキシカルボニルオキシが置換した炭素数1ないし5個
を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数
6ないし10個を有するアリールカルボニルオキシが置
換した炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝
鎖状のアルキル基、炭素数6ないし10個を有するアリ
ールオキシカルボニルオキシが置換した炭素数1ないし
5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基およ
び5位に置換分として炭素数1ないし6個を有する直鎖
状もしくは分枝鎖状のアルキルを有する2-オキソ-

(40)

77

1, 3-ジオキソレン-4-イルメチル基をあげることができる。

【0076】ここに、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基および炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基は、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピルまたは1, 2, 2-トリメチルプロピルであり得、好適には炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり、更に好適にはメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチルまたはイソブチルであり、最適にはメチルまたはエチルである。

【0077】炭素数7ないし19個を有するアラルキル基は、例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチルまたはジフェニルメチルであり得、好適にはベンジルである。炭素数5ないし7個を有するシクロアルキル基は、例えばシクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルであり、好適にはシクロヘキシルである。

【0078】炭素数6ないし10個を有するアリアル基は、例えばフェニルまたはナフチルであり得、好適にはフェニルである。

【0079】好適なエステル残基の具体例は、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、t-ブチル、ベンジル、アセトキシメチル、1-(アセトキシ)エチル、プロピオニルオキシメチル、1-(プロピオニルオキシ)エチル、ブチリルオキシメチル、1-(ブチリルオキシ)エチル、イソブチリルオキシメチル、1-(イソブチリルオキシ)エチル、バレリルオキシメチル、1-(バレリルオキシ)エチル、イソバレリルオキシメチル、1-(イソバレリルオキシ)エチル、ピパロイルオキシメチル、1-(ピパロイルオキシ)エチル、メトキシカルボニルオキシメチル、1-(メトキシカルボニルオキシ)エチル、エトキシカルボニルオキシメチル、1-(エトキシカルボニルオキシ)エチル、プロボキシカルボニルオキシメチル、1-(プロボキシカルボニルオキシ)エチル、イソプロボキシカルボニルオキシメチル、1-(イソプロボキシカルボニルオキシ)エチル、ブトキシカルボニルオキシメチル、1-(ブトキシカルボニルオキシ)エチル、イソブトキ

78

シカルボニルオキシメチル、1-(イソブトキシカルボニルオキシ)エチル、t-ブトキシカルボニルオキシメチル、1-(t-ブトキシカルボニルオキシ)エチル、シクロペンタンカルボニルオキシメチル、1-(シクロペンタンカルボニルオキシ)エチル、シクロヘキサンカルボニルオキシメチル、1-(シクロヘキサンカルボニルオキシ)エチル、シクロペンチルオキシカルボニルオキシメチル、1-(シクロペンチルオキシカルボニルオキシ)エチル、シクロヘキシルオキシカルボニルオキシメチル、1-(シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ)エチル、ベンゾイルオキシメチル、1-(ベンゾイルオキシ)エチル、フェノキシカルボニルオキシメチル、1-(フェノキシカルボニルオキシ)エチルまたは5-メチル-2-オキソ-1, 3-ジオキソレン-4-イルメチルである。

【0080】なお、前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルは、種々の異性体を有する。例えばカルボン酸の α 位炭素の不斉に由来する光学異性体が存在する。前記一般式(I)においては、これら不斉炭素原子に基づく立体異性体およびこれら異性体の等量および非等量混合物がすべて単一の式で示されている。従って、本発明においてはこれらの異性体およびこれらの異性体の混合物をもすべて含むものである。

【0081】更に本発明において、前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルが溶剤と物(例えば水と物)を形成する場合には、これらもすべて含むものである。

【0082】更に本発明において、生体内において代謝されて前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体またはその塩に変換される化合物、例えばアミド誘導体のような、いわゆるプロドラッグもすべて含むものである。

【0083】前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体において、好適には

(1) R^1 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(2) R^1 が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(3) R^1 が水素原子または炭素数1もしくは2個を有するアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(4) R^1 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、

(41)

79

その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(5) R^2 が炭素数2ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(6) R^2 が炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(7) R^2 がエチレン基、トリメチレン基またはメチルエチレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(8) R^2 がエチレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(9) R^3 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1もしくは2個を有するアルコキシ基、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ基、ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ基、または炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(10) R^3 が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(11) R^3 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(12) R^4 が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(13) R^4 が水素原子または炭素数1もしくは2個を有するアルキル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(14) R^4 が水素原子またはメチル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(15) R^4 が水素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(16) R^4 がメチル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(17) Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容され

80

るエステル。

(18) Zが炭素数1または2個を有するアルキレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(19) Zがメチレン基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(20) Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) ヒドロキシ基、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) 1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、

(vi) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii) ア

リール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数

7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1

ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環基、(xiii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基、(xiv) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基、(xv) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環基を示し、ここに置換分 α^1 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

状の炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(vii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(viii) ヒドロキシ、(ix) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(x) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(xi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

状の炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(xii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(xiii) ヒドロキシ、(xiv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(xv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(xvi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

状の炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(xvii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(xviii) ヒドロキシ、(xix) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(xx) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(xxi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

状の炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(xxii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(xxiii) ヒドロキシ、(xxiv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(xxv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(xxvi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

状の炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(xxvii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(xxviii) ヒドロキシ、(xxix) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(xxx) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(xxxi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

(42)

81

状のアルコキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、

(v i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(i x) 1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(x i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(x i i) ハロゲン原子、(x i i i) ニトロ、(x i v) シアノ、

(x v) アミノ、(x v i) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v i i) アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(x v i i i) アラルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ、(x i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(x x i) 同一または異なって1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール、

(x x i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(x x i i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(x x i v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル、(x x v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ

(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x v i) 1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ、(x x i x) 1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4

82

個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル、(x x x) 複素芳香環部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)および(x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換基 β

1は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、

(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、

(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) アミノ、

(x i v) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(x v i i) モノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル、(x v i i i) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキル、(x i x) アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノまたは(x x) アリール部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(21) Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i) ヒドロキシ基、(i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ

50

(43)

83

基、(v) 1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(xiii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基を示し、ここに置換分 α^2 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(vii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(viii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(ix) ハロゲン原子、(x) ニトロ、(xi) シアノ、(xii) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xiii) 同一または異なって1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール、(xiv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(xv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(xvi) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香

84

環、(xvii) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(xviii) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオまたは(xix) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^2 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v) ハロゲン原子、(vi) ニトロ、(vii) ホルミル、(viii) カルボキシル、(ix) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノまたは(x) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル、(22) Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(iv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(vi) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(vii) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(ix) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる

(44)

85

群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α^3 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノおよび(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(23) Wが、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iii)フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 α^4 を有していてもよいフェノキシ基、(iv)フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 α^4 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するフェニルチオ基、(v)炭素数7ないし10個を有するアラルキル基、(vi)炭素数7ないし10個を有するアラルキルオキシ基、(vii)アリアル部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状であり炭素数1ないし4個を有するアリアルオキシアリル基、(viii)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(ix)酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α^4 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノまたは(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(24) Wがフェニル部分に1個の後述する置換分 α^5 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^5 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もし

86

くは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノまたは(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(25) Wがフェニル部分に1個の後述する置換分 α^6 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^6 は、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子または塩素原子からなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(26) Wが、フェノキシ基、メチルフェノキシ基、エチルフェノキシ基、イソプロピルフェノキシ基、*t*-ブチルフェノキシ基、トリフルオロメチルフェノキシ基、メトキシフェノキシ基、トリフルオロメトキシフェノキシ基、フルオロフェノキシ基またはクロロフェノキシ基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(27) Xが1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリアル基または1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^7 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v)炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(vi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(viii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(ix)1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(xi)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(xii)ハロゲン原子、(xiii)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ない

(45)

87

し4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x i v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラキル、(x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニル、(x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェノキシ、(x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルチオ、(x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニル、(x i x) フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x) フリル、(x x i) チェニル、(x x i i) オキサゾリル、(x x i i i) イソオキサゾリル、(x x i v) チアゾリル、(x x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジル、(x x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルオキシ、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルチオ、(x x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニル、

(x x i x) イミダゾリル(環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x x) ピリジル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。-)および(x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^3 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、

(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状である

88

ジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(28) Xが1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^8 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニル、(x i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェノキシ、(x i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニルチオ、(x i i i) フリル、(x i v) チェニル、(x v) オキサゾリル、(x v i) イソオキサゾリル、(x v i i) チアゾリル、(x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいピリジル、(x i x) イミダゾリル(環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。-)および(x x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^4 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部

(46)

89

分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(29) Xが1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^9 は、(i) ヒドロキシ、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(iv) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、

(v) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェニル、(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^5 は、

(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアリル、(vi) ハロゲン原子、(vii) ニトロ、(viii) ホルミル、(ix) カルボキシル、

(x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(30) Xが1ないし3個の後述する置換分 α^{10} を有していてもよいフェニル基、ナフチル基、イミダゾイル基、オキサゾイル基、ピリジル基、インドリル基、キノリル基またはイソキノリル基であり、ここに置換分 α^{10} は、(i) ヒドロキシ、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖

90

状のハロゲン化アルコキシ、(iv) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(v) 1ないし3個の後述する置換分 β^6 を有していてもよいフェニル、

(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^6 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^6 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^6 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアリル、(vi) ハロゲン原子、(vii) ニトロ、(viii) ホルミル、(ix) カルボキシル、(x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(31) Xが1ないし3個の後述する置換分 α^{11} を有していてもよいフェニル基、インドリル基、ピリジル基またはキノリル基であり、ここに置換分 α^{11} は、(i) ヒドロキシ、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(iv) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(v) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいフェニル、(vi) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいフェノキシ、(vii) 1ないし3個の後述する置換分 β^7 を有していてもよいピリジルおよび(viii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^7 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは

(47)

91

分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i) ハロゲン原子、(v i i) ニトロ、(v i i i) ホルミル、(i x) カルボキシル、(x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(32) Xが1個の後述する置換分 α^{12} を有していてもよいフェニル基であり、ここに置換分 α^{12} は、メチル、イソプロピル、ヒドロキシ、フッ素原子、塩素原子、ジエチルアミノ、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は同一または異なって、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メチレンジオキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ホルミル、シアノ、カルボキシル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、もしくはN、N-ジメチルアミノメチルで1ないし3個置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、ピリジル(該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで置換されていてもよい。)、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルスルホニルおよびピペリジルからなる群から選択されるものである。あるいは、Xが1個の後述する置換分 α^{13} を有していてもよいピリジル基であり、ここに置換分 α^{13} は、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、ベンジルオキシ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジエチルアミノで置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノおよびN-メチルフェニルスルホニルアミノからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(33) Xが1個の後述する置換分 α^{12} を有していてもよいフェニル基であり、ここに置換分 α^{12} は、メチル、イソプロピル、ヒドロキシ、フッ素原子、塩素原子、ジエチルアミノ、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は同一または異なって、メチル、エチル、トリフルオロメ

92

チル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メチレンジオキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ホルミル、シアノ、カルボキシル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、もしくはN、N-ジメチルアミノメチルで1ないし3個置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、ピリジル(該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで置換されていてもよい。)、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルスルホニルおよびピペリジルからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(34) Xが1個の後述する置換分 α^{13} を有していてもよいピリジル基であり、ここに置換分 α^{13} は、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、ベンジルオキシ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジエチルアミノで置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノおよびN-メチルフェニルスルホニルアミノからなる群から選択されるものであるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(35) Xが2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシピリジル基またはフェニルピリジル基(該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジエチルアミノで1個置換されていてもよい。)であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(36) Xがビフェニル基(該フェニル部分は同一または異なって、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ホルミル、カルボキシル、ニトロ、ジメチルアミノまたはN、N-ジメチルアミノメチルで1個置換されていてもよい。)、ピリジルフェニル基(該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで1個置換されていてもよい。)またはフェニルピリジル基(該フェニル部分はメチル、エチル、ト

(48)

93

リフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、もしくはジメチルアミノで1個置換されていてもよい。)であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(37) Xが、ビフェニル基、(メチルフェニル)フェニル基、(トリフルオロメチルフェニル)フェニル基、(ヒドロキシフェニル)フェニル基、(メトキシフェニル)フェニル基、(ヒドロキシメチルフェニル)フェニル基、(フルオロフェニル)フェニル基、(クロロフェニル)フェニル基、(ホルミルフェニル)フェニル基、(カルボキシルフェニル)フェニル基、(ニトロフェニル)フェニル基、(ジメチルアミノフェニル)フェニル基または(N, N-ジメチルアミノメチルフェニル)フェニル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(38) Xが、ビフェニル基、(メチルフェニル)フェニル基、(トリフルオロメチルフェニル)フェニル基、(メトキシフェニル)フェニル基、(フルオロフェニル)フェニル基または(クロロフェニル)フェニル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(39) Xが、ビフェニル基、(フルオロフェニル)フェニル基または(クロロフェニル)フェニル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(40) Xが、ピリジルフェニル基(ピリジル部分にメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノを1個有していてもよい)であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(41) Xが、ピリジルフェニル基、(メチルピリジル)フェニル基、(メトキシピリジル)フェニル基または(ジメチルアミノピリジル)フェニル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(42) Xが、フェニルピリジル基(フェニル部分にメチル、エチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子またはジメチルアミノを1個有していてもよい)であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(43) Xが、フェニルピリジル基、(メトキシフェニル)ピリジル基または(フルオロフェニル)ピリジル基であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(44) Yが単結合、酸素原子、硫黄原子または式 $N-R^5$ を有する基(式中、 R^5 は水素原子、炭素数1

94

もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数2ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示す。)であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(45) Yが単結合または酸素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(46) Yが酸素原子であるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

【0084】更に、(1)乃至(4)から R^1 を選択し、(5)乃至(8)から R^2 を選択し、(9)乃至(11)から R^3 を選択し、(12)乃至(16)から R^4 を選択し、(17)乃至(19)からZを選択し、(20)乃至(26)からWを選択し、(27)乃至(43)からXを選択し、(44)乃至(46)からYを選択して、組み合わせた化合物も好適である。

【0085】例えば、前記一般式(I)を有するフェニルアルキルカルボン酸において、

(47) R^1 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラルキル基であり; R^2 が炭素数2ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり; R^3 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1もしくは2個を有するアルコキシ基、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ基、ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ基、または炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基であり; R^4 が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり;Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり;Wが、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii)ヒドロキシ基、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v)1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x)アリール部分に1ないし3

(v) 1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、(viii)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix)アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x)アリール部分に1ないし3

(49)

95

個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(x i) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(x i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環基、(x i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基、(x i v) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基、(x v) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環基を示し、ここに置換分 α^1 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(i x) 1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(x i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(x i i) ハロゲン原子、(x i i i) ニトロ、(x i v) シアノ、(x v) アミノ、(x v i) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v i i) アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノ、(x v i i i) アラルキル部分が炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノ、(x i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(x x i) 同一または異なって1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール、(x x i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基

96

分 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(x x i i i) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(x x i v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル、(x x v) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^1 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ (該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(x x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ、(x x i x) 1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル、(x x x) 複素芳香環部分に1ないし3個の後述する置換分 β^1 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニルアミノ (該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および (x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^1 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) アミノ、(x i

(50)

97

v) アルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ、(x v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアミノアルキル、(x v i i) モノアルキルアミノ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを1個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルであるモノアルキルアミノアルキル、(x v i i i) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキル、(x i x) アルコキシ部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニルアミノまたは(x x) アリール部分が炭素数6ないし10個を有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有するアラルキルオキシカルボニルアミノからなる群から選択されるものであり; Xが1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^7 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^7 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(i x) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ、(x) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(x i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(x i i) ハロゲン原子、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x i v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル、(x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニル、(x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェノキシ、(x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有してい

98

てもよいフェニルチオ、(x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニル、(x i x) フェニル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいフェニルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x) フリル、(x x i) チェニル、(x x i i) オキサゾリル、(x x i i i) イソオキサゾリル、(x x i v) チアゾリル、(x x v) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジル、(x x v i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルオキシ、(x x v i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルチオ、(x x v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニル、(x x i x) イミダゾリル(環の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。)、(x x x) ピリジル部分に1ないし3個の後述する置換分 β^3 を有していてもよいピリジルスルホニルアミノ(該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および(x x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^3 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり; Yが単結合または酸素原子である; アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(48) R^1 が水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし9個を有するアラルキル基であり; R^2 が炭素数2

(51)

99

ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり; R^3 が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であり; R^4 が水素原子または炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり; Zがメチレン基であり; Wが、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(ii) ヒドロキシ基、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、(v) 1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基、(vi) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基、(vii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基、

(viii) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、(ix) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、(x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキルチオ基、(xi) アリール部分が1ないし3個の後述する置換分 α^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数1ないし4個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(xii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環オキシ基または(xiii) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環複素芳香環チオ基を示し、ここに置換分 α^2 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、

(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、

(vii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(viii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(ix) ハロゲン原子、(x) ニトロ、(xi) シアノ、(xii) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(xiii) 同一または異なって1ないし3個の後述する置換基 β^2 を有していてもよい

100

炭素数6ないし10個を有するアリール、(xiv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ、(xv) アリール部分に1ないし3個の後述する置換基 β^2 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリールチオ、(xvi) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環、(xvii) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ、(xviii) 1ないし3個の後述する置換分 β^2 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環飽和複素環からなる群から選択されるものを示し、ここに置換分 β^2 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロシアルキル、(v) ハロゲン原子、(vi) ニトロ、

(vii) ホルミル、(viii) カルボキシル、(ix) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノまたは(x) ジアルキル部分が同一または異なって炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり; Xが1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α^8 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^8 は、(i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii) ヒドロキシ、(iv) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ、(v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(vi) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ

(52)

101

シ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(x) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニル、(x i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェノキシ、

(x i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいフェニルチオ、(x i i i) フリル、(x i v) チエニル、(x v) オキサゾリル、(x v i) イソオキサゾリル、(x v i i) チアゾリル、(x v i i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^4 を有していてもよいピリジル、(x i x) イミダゾリル (環の窒素原子は炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。) および (x x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員飽和複素環からなる群から選択され、ここに置換分 β^4 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) ヒドロキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ、(v i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(v i i i) ハロゲン原子、(i x) ニトロ、(x) ホルミル、(x i) シアノ、(x i i) カルボキシル、(x i i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび (x i v) ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数 1 ないし 4 個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を 2 個有しアルキル部分が炭素数 1 ないし 4 個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり；Y が酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(49) R^1 が水素原子、炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数 7 ないし 9 個を有するアラルキル基であり； R^2 が炭素数 2 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり； R^3 が水素原子、ハロゲン原子またはニトロ基であり； R^4 が水素原子または炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Z がメチレン基であり；W が、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、(i i i) アリール部分に 1 ないし

102

3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールオキシ基、(i v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールチオ基、(v) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 7 ないし 12 個を有するアラルキル基、(v i) アリール部分に 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 7 ないし 12 個を有するアラルキルオキシ基、(v i i) アリール部分が 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^3 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリールでありアルキル部分が直鎖状もしくは分枝鎖状の炭素数 1 ないし 4 個を有するアルキルであるアリールオキシアルキル基、(v i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環複素芳香環オキシ基または (i x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環複素芳香環チオ基であり、ここに置換分 α^3 は、(i) 炭素数 1 ないし 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(v i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル、(v i i) ハロゲン原子、(v i i i) シアノおよび (i x) ピリジルからなる群から選択されるものであり；X が 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい炭素数 6 ないし 10 個を有するアリール基または 1 ないし 3 個の後述する置換分 α^9 を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員環の複素芳香環基であり、ここに置換分 α^9 は、(i) ヒドロキシ、(i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(i i i) 炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(i v) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数 1 ないし 4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ、(v) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェニル、(v i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいフェノキシ、(v i i) 1 ないし 3 個の後述する置換分 β^5 を有していてもよいピリジルおよび (v i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を 1 ないし 4 個含有する 1 環もしくは 2 環の 5 ないし 10 員飽和複素環からなる群から選択され、こ

(53)

103

ここに置換分 β^5 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)ヒドロキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(v)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のヒドロキシアルキル、(vi)ハロゲン原子、(vii)ニトロ、(viii)ホルミル、(ix)カルボキシル、(x)同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノおよび(xi)ジアルキルアミノ部分に同一もしくは異なって炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を2個有しアルキル部分が炭素数1ないし4個の直鎖状もしくは分枝鎖状であるジアルキルアミノアルキルからなる群から選択されるものであり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(50) R^1 が水素原子であり； R^2 がエチレン基であり； R^3 が水素原子であり； R^4 が水素原子であり；Zがメチレン基であり；Wが、フェニル部分に1個の後述する置換分 α^5 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^5 は、(i)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、(ii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、(iii)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、(iv)炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ、(v)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ、(vi)炭素数1もしくは2個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル(vii)ハロゲン原子、(viii)シアノまたは(ix)ピリジルからなる群から選択されるものであり；Xが1個の後述する置換分 α^{12} を有していてもよいフェニル基であり、ここに置換分 α^{12} は、メチル、イソプロピル、ヒドロキシ、フッ素原子、塩素原子、ジエチルアミノ、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は同一または異なって、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メチレンジオキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ホルミル、シアノ、カルボキシル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、もしくはN、N-ジメチルアミノメチルで1ないし3個置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノ、N-メチルフェニルスルホニルアミノ、ピリジル(該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで置換され

104

ていてもよい。)、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルスルホニルおよびペリリルからなる群から選択されるものである、あるいは、Xが1個の後述する置換分 α^{13} を有していてもよいピリジル基であり、ここに置換分 α^{13} は、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、ベンジルオキシ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルチオ、炭素数1もしくは2個を有するアルキルスルホニル、ベンジル、フェニル(該フェニル部分は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノもしくはジエチルアミノで置換されていてもよい。)、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニルスルホニルアミノおよびN-メチルフェニルスルホニルアミノからなる群から選択されるものであり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

(51) R^1 が水素原子であり； R^2 がエチレン基であり； R^3 が水素原子であり； R^4 が水素原子であり；Zがメチレン基であり；Wが、フェニル部分に1個の後述する置換分 α^6 を有していてもよいフェノキシ基であり、ここに置換分 α^6 は、メチル、エチル、イソプロピル、 t -ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子または塩素原子からなる群から選択されるものであり；Xがビフェニル基(該フェニル部分は同一または異なって、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、フッ素原子、塩素原子、ホルミル、カルボキシル、ニトロ、ジメチルアミノまたはN、N-ジメチルアミノメチルで1個置換されていてもよい。)、ピリジルフェニル基(該ピリジル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノで1個置換されていてもよい。)、またはフェニルピリジル基(該フェニル部分はメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、フッ素原子、塩素原子、ニトロ、もしくはジメチルアミノで1個置換されていてもよい。))であり；Yが酸素原子である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

【0086】更に、次の組み合わせによる化合物も好適である。

(52) R^1 が水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり； R^2 が炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり； R^3 が、(i)水素原子、(ii)炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、(iii)炭素数1ないし4個

(54)

105

を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、
 (i v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、 (v) ハロゲン原子、
 (v i) ニトロ基、 (v i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、 (v i i i) 1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または (i x) アリール部分に1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数7ないし12個を有するアラルキル基であり；R⁴が水素原子または炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基であり；Zが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレン基であり；Wが、エチル基、プロピル基、ブチル基、ペンチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、フェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基または4-フェニルブチル基であり；Xが1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または1ないし3個の後述する置換分 α を有していてもよい酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基であり、ここに置換分 α は (i) 炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、 (i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル基、 (i i i) ヒドロキシ基、 (i v) 炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシルオキシ基、
 (v) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、 (v i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシ基、 (v i i) 炭素数7ないし12個を有するアラルキルオキシ基、 (v i i i) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、 (i x) 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルスルホニル基、 (x) ハロゲン原子、
 (x i) ニトロ基、 (x i i) 同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基、 (x i i i) 炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、 (x i v) 炭素数6ないし10個を有するアリール基（該アリール部分は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、ハ

106

ロゲンまたは炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシで置換されていてもよい。）、 (x v) 炭素数6ないし10個を有するアリールオキシ基（該アリール部分は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、ハロゲンまたは炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシで置換されていてもよい。）、 (x v i) 炭素数6ないし10個を有するアリールチオ基（該アリール部分は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、ハロゲンまたは炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシで置換されていてもよい。）、 (x v i i) 炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニル基（該アリール部分は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、ハロゲンまたは炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシで置換されていてもよい。）、 (x v i i i) 炭素数6ないし10個を有するアリールスルホニルアミノ基（該アリール部分は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲン化アルキル、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ、ハロゲンまたは炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンジオキシで置換されていてもよい。該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。）、 (x i x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環基、 (x x) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環オキシ基、 (x x i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環チオ基、 (x x i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホニル基、および (x x i i i) 酸素原子、窒素原子および硫黄原子からなる群から選択されるヘテロ原子を1ないし4個含有する1環もしくは2環の5ないし10員複素芳香環スルホ

(55)

107

ニルアミノ基（該アミノ部分の窒素原子は炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルで置換されていてもよい。）からなる群から選択されるものであり；Yが単結合、酸素原子、硫黄原子または式 $>N-R^5$ を有する基（式中、 R^5 は水素原子、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。）である；アミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステル。

【0087】本発明の前記一般式（I）を有するアミドカルボン酸、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルの具体例としては、次に例示する化合物をあげることができる。

【0088】なお、表1ないし表155において、略号は以下の基を示す。

【0089】Ac：アセチル、Bu：ブチル、tBu：t-ブチル、Bimid：ベンゾイミダゾリル、Boxa：ベンゾオキサゾリル、Bthiz：ベンゾチアゾリル、Bz：ベンジル、Dea：ジエチルアミノ、Dma：ジメチルアミノ、Dmam：ジメチルアミノメチル、Et：エチル、Fur：フリル、Hex：ヘキシ*

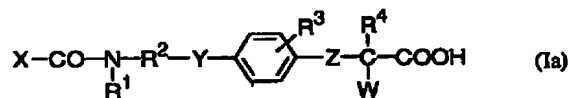
108

*ル、Imid：イミダゾリル、Ind：インドリル、Isox：イソオキサゾリル、MdO：メチレンジオキシ、Me：メチル、Mor：モルホリノ、Np：ナフチル、Oxa：オキサゾリル、Pen：ペンチル、Ph：フェニル、Pip：ピペリジニル、PPr：3-フェニルプロピル、Pr：プロピル、iPr：イソプロピル、Pym：ピリミジニル、Pyr：ピリジニル、Pyrd：ピロリジニル、Pyrri：ピロリル、Pyza：ピラゾリル、Quin：キノリル、iQuin：イソキノリル、Tfp：2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピル、Thi：チエニル、Thiz：チアゾリル。

【0090】なお、表1ないし表145の化合物は、下記式（Ia）を有し、表146ないし表155の化合物は、下記式（Ib）を有する。

【0091】

【化3】



【0092】

【表1】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
1-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	Ph	0
1-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	1-Np	0
1-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Np	0
1-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Me-Ph	0
1-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Et-Ph	0
1-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-iPr-Ph	0
1-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-iPr-Ph	0
1-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-tBu-Ph	0
1-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-tBu-Ph	0
1-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-F-Ph	0
1-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-F-Ph	0
1-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	EtO	4-Cl-Ph	0
1-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Br-Ph	0
1-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-Ph	0
1-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
1-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-BzO-Ph	0
1-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Bz-Ph	0
1-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-PhO-Ph	0
1-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-PhO-Ph	0
1-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-PhS-Ph	0
1-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-PhS-Ph	0
1-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	EtO	3-PhSO ₂ -Ph	0

(56)

109

110

1-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-PhSO ₂ -Ph	0
1-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Imid-1)-Ph	0
1-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Imid-1)-Ph	0
1-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Imid-4)-Ph	0
1-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Imid-4)-Ph	0
1-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Fur-2)-Ph	0
1-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Fur-2)-Ph	0
1-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Thi-2)-Ph	0
1-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Thi-2)-Ph	0
1-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	EtO	3-(Thi-3)-Ph	0
1-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Thi-3)-Ph	0
1-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Pyr-2)-Ph	0
1-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
1-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Pyr-3)-Ph	0
1-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
1-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Pyr-4)-Ph	0
1-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
1-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Oxa-2)-Ph	0
1-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Oxa-2)-Ph	0
1-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	EtO	3-(Oxa-4)-Ph	0
1-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Oxa-4)-Ph	0
1-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Oxa-5)-Ph	0
1-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Oxa-5)-Ph	0
1-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Thiz-2)-Ph	0
1-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Thiz-2)-Ph	0
1-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Thiz-4)-Ph	0
1-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Thiz-4)-Ph	0
1-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(Thiz-5)-Ph	0
1-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Thiz-5)-Ph	0
1-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	1-Me-2-Pyrr	0
1-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Ph-2-Pyrr	0
1-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Bz-2-Pyrr	0
1-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Me-2-Fur	0
1-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Ph-2-Fur	0
1-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Me-2-Thi	0
1-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Ph-2-Thi	0
1-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Me-3-Thi	0
1-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Ph-3-Thi	0
1-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-3-Pyza	0
1-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	EtO	1-Ph-3-Pyza	0
1-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-2-Imid	0
1-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Ph-2-Imid	0
1-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-4-Imid	0
1-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Ph-4-Imid	0
1-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Oxa	0
1-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Oxa	0
1-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-4-Oxa	0
1-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-4-Oxa	0
1-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Oxa	0
1-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	EtO	2-Ph-5-Oxa	0

(57)

111						112		
1-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
1-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
1-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Thiz	0
1-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	5-Thiz	0
1-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-4-Thiz	0
1-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-4-Thiz	0
1-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Thiz	0
1-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Thiz	0
1-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
1-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	EtO	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
1-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-4-Pyza	0
1-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Ph-4-Pyza	0
1-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-4-Isox	0
1-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-4-Isox	0
1-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	0
1-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	0
1-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	0
1-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Me-5-Pyr	0
1-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Et-5-Pyr	0
1-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	EtO	3-Ph-5-Pyr	0
1-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	0
1-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-BzO-5-Pyr	0
1-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	0
1-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	0
1-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	0
1-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	0
1-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	0
1-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	0
1-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
1-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
1-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
1-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
1-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Bz-5-Pyr	0
1-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhO-5-Pyr	0
1-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhS-5-Pyr	0
1-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
1-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Me-6-Pyr	0
1-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	0
1-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-6-Pyr	0
1-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	EtO	2-Ph-6-Pyr	0
1-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-4-Pym	0
1-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-4-Pym	0
1-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-4-Pym	0
1-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-4-Pym	0
1-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-4-Pym	0
1-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-4-Pym	0
1-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-4-Pym	0
1-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrS-4-Pym	0
1-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	6-MeS-4-Pym	0
1-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	EtO	6-EtS-4-Pym	0

(58)

113

114

1-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	6-iPrS-4-Pym	0
1-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhS-4-Pym	0
1-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
1-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
1-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
1-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
1-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pym	0
1-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pym	0
1-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pym	0
1-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pym	0
1-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pym	0
1-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pym	0
1-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pym	0
1-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrS-5-Pym	0
1-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhS-5-Pym	0
1-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
1-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
1-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
1-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
1-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	EtO	2-Ind	0
1-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ind	0
1-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-2-Ind	0
1-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-3-Ind	0
1-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Bimid	0
1-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Boxa	0
1-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Bthiz	0
1-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Quin	0
1-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Quin	0
1-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Quin	0
1-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	1-iQuin	0
1-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-iQuin	0
1-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-iQuin	0
1-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-MeO-Ph	0
1-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-MeO-Ph	0
1-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-EtO-Ph	0
1-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-EtO-Ph	0
1-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-iPrO-Ph	0
1-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-iPrO-Ph	0
1-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-MeS-Ph	0
1-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	EtO	4-MeS-Ph	0
1-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-EtS-Ph	0
1-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-EtS-Ph	0
1-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-iPrS-Ph	0
1-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-iPrS-Ph	0
1-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-MeSO ₂ -Ph	0
1-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-MeSO ₂ -Ph	0
1-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-EtSO ₂ -Ph	0
1-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-EtSO ₂ -Ph	0
1-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	EtO	3-iPrSO ₂ -Ph	0

(59)

115						116		
1-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-iPrSO ₂ -Ph	0
1-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
1-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
1-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1-Me-2-Ph-4-Imid	0
1-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1, 4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
1-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	1, 5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
1-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3, 4-MdO-Ph	0
1-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	EtO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
1-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3, 4-MdO-Ph)-Ph	0
1-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0
1-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
1-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
1-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph	0
1-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0
1-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0
1-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
1-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph	0
1-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
1-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
1-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
1-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0
1-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-HO-5-Pyr	0
1-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-BzO-5-Pyr	0
1-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0
1-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
1-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
1-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-HO-Ph	0
1-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-HO-Ph	0
1-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-HO-4, 6-di-Me-Ph	0
1-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-HO-3, 5-di-Me-Ph	0
1-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-AcO-Ph	0
1-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-AcO-Ph	0
1-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
1-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
1-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
1-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
1-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
1-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
1-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
1-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
1-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
1-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
1-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
1-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	EtO	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0

(60)

117						118		
1-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
1-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
1-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
1-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
1-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
1-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
1-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
1-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
1-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
1-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
1-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
1-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
1-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
1-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pip-Ph	0
1-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Dea-Ph	0
1-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
1-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
1-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
1-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
1-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	EtO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
1-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
1-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
1-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
1-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
1-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
1-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
1-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
1-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
1-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	EtO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
1-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
1-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0
1-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-F-Ph)-5-Pyr	0
1-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
1-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
1-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
1-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
1-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
1-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
1-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	EtO	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0093】

* * 【表2】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
2-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	Ph	0
2-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Np	0
2-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Np	0

(61)

119							120	
2-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Me-Ph	0
2-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Et-Ph	0
2-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-iPr-Ph	0
2-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-iPr-Ph	0
2-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-tBu-Ph	0
2-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-tBu-Ph	0
2-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-F-Ph	0
2-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-F-Ph	0
2-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Cl-Ph	0
2-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Br-Ph	0
2-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Ph-Ph	0
2-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Ph-Ph	0
2-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-BzO-Ph	0
2-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Bz-Ph	0
2-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-PhO-Ph	0
2-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-PhO-Ph	0
2-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-PhS-Ph	0
2-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-PhS-Ph	0
2-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-PhSO ₂ -Ph	0
2-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ²⁰	MeO	4-PhSO ₂ -Ph	0
2-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Imid-1)-Ph	0
2-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Imid-1)-Ph	0
2-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Imid-4)-Ph	0
2-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Imid-4)-Ph	0
2-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Fur-2)-Ph	0
2-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Fur-2)-Ph	0
2-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Thi-2)-Ph	0
2-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Thi-2)-Ph	0
2-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Thi-3)-Ph	0
2-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Thi-3)-Ph	0
2-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Pyr-2)-Ph	0
2-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Pyr-2)-Ph	0
2-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Pyr-3)-Ph	0
2-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Pyr-3)-Ph	0
2-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Pyr-4)-Ph	0
2-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Pyr-4)-Ph	0
2-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Oxa-2)-Ph	0
2-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Oxa-2)-Ph	0
2-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Oxa-4)-Ph	0
2-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Oxa-4)-Ph	0
2-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Oxa-5)-Ph	0
2-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Oxa-5)-Ph	0
2-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Thiz-2)-Ph	0
2-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Thiz-2)-Ph	0
2-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Thiz-4)-Ph	0
2-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Thiz-4)-Ph	0
2-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(Thiz-5)-Ph	0
2-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(Thiz-5)-Ph	0
2-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-2-Pyrr	0

(62)

121							122	
2-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Ph-2-Pyrr	0
2-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Bz-2-Pyrr	0
2-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Me-2-Fur	0
2-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Ph-2-Fur	0
2-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Me-2-Thi	0
2-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Ph-2-Thi	0
2-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Me-3-Thi	0
2-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Ph-3-Thi	0
2-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-3-Pyza	0
2-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Ph-3-Pyza	0
2-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-2-Imid	0
2-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Ph-2-Imid	0
2-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-4-Imid	0
2-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Ph-4-Imid	0
2-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Oxa	0
2-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Oxa	0
2-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-4-Oxa	0
2-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-4-Oxa	0
2-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-5-Oxa	0
2-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-5-Oxa	0
2-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
2-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
2-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Thiz	0
2-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Thiz	0
2-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-4-Thiz	0
2-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-4-Thiz	0
2-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-5-Thiz	0
2-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-5-Thiz	0
2-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
2-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
2-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-4-Pyza	0
2-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Ph-4-Pyza	0
2-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-4-Isox	0
2-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-4-Isox	0
2-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Pyr	0
2-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Pyr	0
2-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Pyr	0
2-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Me-5-Pyr	0
2-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Et-5-Pyr	0
2-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Ph-5-Pyr	0
2-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-5-Pyr	0
2-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-BzO-5-Pyr	0
2-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-5-Pyr	0
2-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeO-5-Pyr	0
2-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtO-5-Pyr	0
2-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrO-5-Pyr	0
2-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeS-5-Pyr	0
2-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtS-5-Pyr	0
2-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
2-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0

(63)

123						124		
2-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
2-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
2-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Bz-5-Pyr	0
2-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhO-5-Pyr	0
2-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhS-5-Pyr	0
2-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
2-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Me-6-Pyr	0
2-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Ph-6-Pyr	0
2-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-6-Pyr	0
2-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-6-Pyr	0
2-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-4-Pym	0
2-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-4-Pym	0
2-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeO-4-Pym	0
2-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtO-4-Pym	0
2-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrO-4-Pym	0
2-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeS-4-Pym	0
2-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtS-4-Pym	0
2-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrS-4-Pym	0
2-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	6-MeS-4-Pym	0
2-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	6-EtS-4-Pym	0
2-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	6-iPrS-4-Pym	0
2-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhS-4-Pym	0
2-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
2-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
2-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
2-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
2-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Me-5-Pym	0
2-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ph-5-Pym	0
2-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeO-5-Pym	0
2-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtO-5-Pym	0
2-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrO-5-Pym	0
2-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeS-5-Pym	0
2-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtS-5-Pym	0
2-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrS-5-Pym	0
2-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhS-5-Pym	0
2-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
2-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
2-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
2-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
2-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Ind	0
2-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Ind	0
2-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-2-Ind	0
2-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-3-Ind	0
2-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Bimid	0
2-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Boxa	0
2-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Bthiz	0
2-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-Quin	0
2-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-Quin	0
2-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-Quin	0
2-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-iQuin	0

(64)

125						126	
2-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-iQuin 0
2-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-iQuin 0
2-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-MeO-Ph 0
2-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-MeO-Ph 0
2-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-EtO-Ph 0
2-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-EtO-Ph 0
2-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-iPrO-Ph 0
2-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-iPrO-Ph 0
2-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-MeS-Ph 0
2-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-MeS-Ph 0
2-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-EtS-Ph 0
2-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-EtS-Ph 0
2-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-iPrS-Ph 0
2-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-iPrS-Ph 0
2-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-MeSO ₂ -Ph 0
2-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-MeSO ₂ -Ph 0
2-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-EtSO ₂ -Ph 0
2-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-EtSO ₂ -Ph 0
2-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ²⁰	MeO	3-iPrSO ₂ -Ph 0
2-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-iPrSO ₂ -Ph 0
2-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-(1-Me-Imid-4)-Ph 0
2-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(1-Me-Imid-4)-Ph 0
2-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1-Me-2-Ph-4-Imid 0
2-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1,4-di-Me-2-Ph-5-Imid 0
2-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	1,5-di-Me-2-Ph-4-Imid 0
2-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3,4-MdO-Ph 0
2-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(4-MeO-Ph)-Ph 0
2-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(3,4-MdO-Ph)-Ph 0
2-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ³⁰	MeO	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph 0
2-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph 0
2-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(PhSO ₂ NH)-Ph 0
2-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph 0
2-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph 0
2-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph 0
2-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph 0
2-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph 0
2-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(4-Me-Ph)-Ph 0
2-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-(4-F-Ph)-Ph 0
2-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ⁴⁰	MeO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph 0
2-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr 0
2-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-HO-5-Pyr 0
2-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-BzO-5-Pyr 0
2-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph 0
2-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-4)O]-Ph 0
2-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-[(Pyr-4)S]-Ph 0
2-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-HO-Ph 0
2-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-HO-Ph 0
2-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	2-HO-4,6-di-Me-Ph 0
2-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-HO-3,5-di-Me-Ph 0

(65)

127							128		
2-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	3-AcO-Ph	0	
2-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeO	4-AcO-Ph	0	

【0094】

* * 【表3】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
3-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Pr	Ph	0
3-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Np	0
3-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Np	0
3-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Me-Ph	0
3-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Et-Ph	0
3-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-iPr-Ph	0
3-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-iPr-Ph	0
3-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-tBu-Ph	0
3-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-tBu-Ph	0
3-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-F-Ph	0
3-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Pr	4-F-Ph	0
3-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Cl-Ph	0
3-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Br-Ph	0
3-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-Ph	0
3-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
3-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-BzO-Ph	0
3-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Bz-Ph	0
3-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-PhO-Ph	0
3-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-PhO-Ph	0
3-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-PhS-Ph	0
3-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Pr	4-PhS-Ph	0
3-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-PhSO ₂ -Ph	0
3-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-PhSO ₂ -Ph	0
3-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Imid-1)-Ph	0
3-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Imid-1)-Ph	0
3-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Imid-4)-Ph	0
3-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Imid-4)-Ph	0
3-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Fur-2)-Ph	0
3-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Fur-2)-Ph	0
3-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Thi-2)-Ph	0
3-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Pr	4-(Thi-2)-Ph	0
3-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Thi-3)-Ph	0
3-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Thi-3)-Ph	0
3-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Pyr-2)-Ph	0
3-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
3-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Pyr-3)-Ph	0
3-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
3-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Pyr-4)-Ph	0
3-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
3-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Oxa-2)-Ph	0
3-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Pr	4-(Oxa-2)-Ph	0

(66)

129

130

3-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Oxa-4)-Ph	0
3-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Oxa-4)-Ph	0
3-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Oxa-5)-Ph	0
3-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Oxa-5)-Ph	0
3-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Thiz-2)-Ph	0
3-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Thiz-2)-Ph	0
3-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Thiz-4)-Ph	0
3-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Thiz-4)-Ph	0
3-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(Thiz-5)-Ph	0
3-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	Ci ₂	Pr	4-(Thiz-5)-Ph	0
3-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-2-Pyrr	0
3-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Ph-2-Pyrr	0
3-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Bz-2-Pyrr	0
3-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Me-2-Fur	0
3-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Ph-2-Fur	0
3-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Me-2-Thi	0
3-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Ph-2-Thi	0
3-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Me-3-Thi	0
3-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Ph-3-Thi	0
3-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₂ ₂	Pr	1-Me-3-Pyza	0
3-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Ph-3-Pyza	0
3-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-2-Imid	0
3-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Ph-2-Imid	0
3-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-4-Imid	0
3-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Ph-4-Imid	0
3-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Oxa	0
3-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Oxa	0
3-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-4-Oxa	0
3-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-4-Oxa	0
3-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₃ ₂	Pr	2-Me-5-Oxa	0
3-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Oxa	0
3-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
3-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
3-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Thiz	0
3-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Thiz	0
3-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-4-Thiz	0
3-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-4-Thiz	0
3-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Thiz	0
3-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Thiz	0
3-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₄ ₂	Pr	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
3-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
3-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-4-Pyza	0
3-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Ph-4-Pyza	0
3-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-4-Isox	0
3-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-4-Isox	0
3-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	0
3-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	0
3-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr	0
3-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Me-5-Pyr	0
3-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₅ ₂	Pr	3-Et-5-Pyr	0

(67)

131						132					
3-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-5-Pyr		0		
3-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr		0		
3-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-BzO-5-Pyr		0		
3-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr		0		
3-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr		0		
3-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr		0		
3-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr		0		
3-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr		0		
3-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr		0		
3-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr		0		
3-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeSO ₂ -5-Pyr		0		
3-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtSO ₂ -5-Pyr		0		
3-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr		0		
3-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Bz-5-Pyr		0		
3-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhO-5-Pyr		0		
3-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhS-5-Pyr		0		
3-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhSO ₂ -5-Pyr		0		
3-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Me-6-Pyr		0		
3-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr		0		
3-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-6-Pyr		0		
3-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-6-Pyr		0		
3-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-4-Pym		0		
3-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-4-Pym		0		
3-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-4-Pym		0		
3-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-4-Pym		0		
3-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-4-Pym		0		
3-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-4-Pym		0		
3-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-4-Pym		0		
3-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrS-4-Pym		0		
3-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	6-MeS-4-Pym		0		
3-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	6-EtS-4-Pym		0		
3-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	6-iPrS-4-Pym		0		
3-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhS-4-Pym		0		
3-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeSO ₂ -4-Pym		0		
3-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtSO ₂ -4-Pym		0		
3-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrSO ₂ -4-Pym		0		
3-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhSO ₂ -4-Pym		0		
3-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pym		0		
3-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pym		0		
3-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pym		0		
3-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pym		0		
3-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pym		0		
3-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pym		0		
3-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pym		0		
3-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrS-5-Pym		0		
3-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhS-5-Pym		0		
3-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeSO ₂ -5-Pym		0		
3-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtSO ₂ -5-Pym		0		
3-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrSO ₂ -5-Pym		0		
3-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-PhSO ₂ -5-Pym		0		

(68)

133

134

3-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ind	0
3-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ind	0
3-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-2-Ind	0
3-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-3-Ind	0
3-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Bimid	0
3-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Boxa	0
3-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Bthiz	0
3-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Quin	0
3-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Quin	0
3-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Quin	0
3-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-iQuin	0
3-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-iQuin	0
3-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-iQuin	0
3-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-MeO-Ph	0
3-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-MeO-Ph	0
3-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-EtO-Ph	0
3-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-EtO-Ph	0
3-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-iPrO-Ph	0
3-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-iPrO-Ph	0
3-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-MeS-Ph	0
3-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-MeS-Ph	0
3-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-EtS-Ph	0
3-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-EtS-Ph	0
3-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-iPrS-Ph	0
3-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-iPrS-Ph	0
3-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-MeSO ₂ -Ph	0
3-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-MeSO ₂ -Ph	0
3-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-EtSO ₂ -Ph	0
3-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-EtSO ₂ -Ph	0
3-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-iPrSO ₂ -Ph	0
3-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-iPrSO ₂ -Ph	0
3-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
3-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
3-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1-Me-2-Ph-4-Imid	0
3-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1,4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
3-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	1,5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
3-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3,4-MdO-Ph	0
3-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
3-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3,4-MdO-Ph)-Ph	0
3-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[PhSO ₂]N(Me)-Ph	0
3-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
3-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
3-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph	0
3-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0
3-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0
3-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
3-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph	0
3-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Me-Ph)-Ph	0

(69)

135						136		
3-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-F-Ph)-Ph	0
3-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
3-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0
3-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-HO-5-Pyr	0
3-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-BzO-5-Pyr	0
3-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0
3-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
3-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
3-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-HO-Ph	0
3-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-HO-Ph	0
3-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-HO-4, 6-di-Me-Ph	0
3-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-HO-3, 5-di-Me-Ph	0
3-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-AcO-Ph	0
3-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-AcO-Ph	0
3-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
3-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
3-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
3-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
3-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
3-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
3-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
3-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
3-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
3-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
3-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
3-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0
3-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
3-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
3-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
3-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
3-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
3-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
3-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
3-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
3-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
3-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
3-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
3-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
3-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
3-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Pip-Ph	0
3-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Dea-Ph	0
3-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
3-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
3-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
3-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
3-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
3-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr	0
3-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
3-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-F-Ph)-Ph	0

(70)

137						138		
3-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
3-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
3-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
3-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
3-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
3-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
3-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
3-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0
3-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-F-Ph)-5-Pyr	0
3-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
3-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
3-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
3-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
3-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
3-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
3-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0095】

* * 【表4】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
4-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	Ph	0
4-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Np	0
4-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Np	0
4-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Me-Ph	0
4-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Et-Ph	0
4-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-iPr-Ph	0
4-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-iPr-Ph	0
4-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-tBu-Ph	0
4-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-tBu-Ph	0
4-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-F-Ph	0
4-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-F-Ph	0
4-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Cl-Ph	0
4-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Br-Ph	0
4-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-Ph	0
4-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
4-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-BzO-Ph	0
4-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Bz-Ph	0
4-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-PhO-Ph	0
4-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-PhO-Ph	0
4-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-PhS-Ph	0
4-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-PhS-Ph	0
4-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-PhSO ₂ -Ph	0
4-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-PhSO ₂ -Ph	0
4-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Imid-1)-Ph	0
4-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Imid-1)-Ph	0
4-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Imid-4)-Ph	0
4-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Imid-4)-Ph	0

(71)

139

140

4-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Fur-2)-Ph	0
4-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Fur-2)-Ph	0
4-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Thi-2)-Ph	0
4-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Thi-2)-Ph	0
4-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Thi-3)-Ph	0
4-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Thi-3)-Ph	0
4-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Pyr-2)-Ph	0
4-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
4-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Pyr-3)-Ph	0
4-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	Ci ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
4-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Pyr-4)-Ph	0
4-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
4-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Oxa-2)-Ph	0
4-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Oxa-2)-Ph	0
4-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Oxa-4)-Ph	0
4-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Oxa-4)-Ph	0
4-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Oxa-5)-Ph	0
4-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Oxa-5)-Ph	0
4-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Thiz-2)-Ph	0
4-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₂ O ₂	Bu	4-(Thiz-2)-Ph	0
4-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Thiz-4)-Ph	0
4-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Thiz-4)-Ph	0
4-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(Thiz-5)-Ph	0
4-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Thiz-5)-Ph	0
4-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-2-Pyrr	0
4-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Ph-2-Pyrr	0
4-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Bz-2-Pyrr	0
4-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Me-2-Fur	0
4-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Ph-2-Fur	0
4-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₃ O ₂	Bu	5-Me-2-Thi	0
4-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Ph-2-Thi	0
4-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Me-3-Thi	0
4-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Ph-3-Thi	0
4-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-3-Pyza	0
4-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Ph-3-Pyza	0
4-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-2-Imid	0
4-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Ph-2-Imid	0
4-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-4-Imid	0
4-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Ph-4-Imid	0
4-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₄ O ₂	Bu	4-Oxa	0
4-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Oxa	0
4-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-4-Oxa	0
4-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-4-Oxa	0
4-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Oxa	0
4-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Oxa	0
4-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
4-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
4-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Thiz	0
4-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Thiz	0
4-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₅ O ₂	Bu	2-Me-4-Thiz	0

(72)

141						142		
4-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-4-Thiz	0
4-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Thiz	0
4-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Thiz	0
4-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
4-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
4-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-4-Pyza	0
4-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Ph-4-Pyza	0
4-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-4-Isox	0
4-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-4-Isox	0
4-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	0
4-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	0
4-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	0
4-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Me-5-Pyr	0
4-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Et-5-Pyr	0
4-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-5-Pyr	0
4-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	0
4-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-BzO-5-Pyr	0
4-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
4-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	0
4-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	0
4-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	0
4-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	0
4-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	0
4-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
4-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
4-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
4-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
4-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Bz-5-Pyr	0
4-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhO-5-Pyr	0
4-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhS-5-Pyr	0
4-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
4-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Me-6-Pyr	0
4-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0
4-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-6-Pyr	0
4-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-6-Pyr	0
4-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-4-Pym	0
4-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-4-Pym	0
4-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-4-Pym	0
4-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-4-Pym	0
4-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-4-Pym	0
4-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-4-Pym	0
4-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-4-Pym	0
4-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrS-4-Pym	0
4-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	6-MeS-4-Pym	0
4-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	6-EtS-4-Pym	0
4-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	6-iPrS-4-Pym	0
4-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhS-4-Pym	0
4-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
4-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtSO ₂ -4-Pym	0

(73)

143

144

4-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
4-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
4-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pym	0
4-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pym	0
4-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pym	0
4-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pym	0
4-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pym	0
4-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pym	0
4-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pym	0
4-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrS-5-Pym	0
4-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhS-5-Pym	0
4-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
4-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
4-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
4-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
4-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ind	0
4-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ind	0
4-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-2-Ind	0
4-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-3-Ind	0
4-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Bimid	0
4-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Boxa	0
4-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Bthiz	0
4-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Quin	0
4-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Quin	0
4-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Quin	0
4-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-iQuin	0
4-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-iQuin	0
4-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-iQuin	0
4-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-MeO-Ph	0
4-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-MeO-Ph	0
4-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-EtO-Ph	0
4-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-EtO-Ph	0
4-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-iPrO-Ph	0
4-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-iPrO-Ph	0
4-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-MeS-Ph	0
4-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-MeS-Ph	0
4-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-EtS-Ph	0
4-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-EtS-Ph	0
4-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-iPrS-Ph	0
4-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-iPrS-Ph	0
4-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-MeSO ₂ -Ph	0
4-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-MeSO ₂ -Ph	0
4-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-EtSO ₂ -Ph	0
4-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-EtSO ₂ -Ph	0
4-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-iPrSO ₂ -Ph	0
4-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-iPrSO ₂ -Ph	0
4-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
4-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
4-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1-Me-2-Ph-4-Imid	0
4-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1,4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0

(74)

145						146					
4-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	1, 5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0			
4-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3, 4-MdO-Ph	0			
4-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0			
4-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3, 4-MdO-Ph)-Ph	0			
4-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0			
4-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph	0			
4-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0			
4-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph	0			
4-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0			
4-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0			
4-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph	0			
4-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph	0			
4-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Me-Ph)-Ph	0			
4-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-F-Ph)-Ph	0			
4-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0			
4-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0			
4-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-HO-5-Pyr	0			
4-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-BzO-5-Pyr	0			
4-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0			
4-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0			
4-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0			
4-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-HO-Ph	0			
4-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-HO-Ph	0			
4-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-HO-4, 6-di-Me-Ph	0			
4-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-HO-3, 5-di-Me-Ph	0			
4-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-AcO-Ph	0			
4-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-AcO-Ph	0			
4-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0			
4-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0			
4-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-Ph)-Ph	0			
4-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0			
4-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0			
4-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0			
4-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0			
4-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0			
4-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0			
4-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-HO-Ph)-Ph	0			
4-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0			
4-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0			
4-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0			
4-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0			
4-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0			
4-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0			
4-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-HO-Ph)-Ph	0			
4-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0			
4-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0			
4-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0			

(75)

147						148		
4-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
4-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
4-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
4-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
4-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pip-Ph	0
4-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Dea-Ph	0
4-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
4-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
4-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
4-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
4-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
4-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
4-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
4-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-F-Ph)-Ph	0
4-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
4-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
4-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
4-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
4-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
4-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
4-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
4-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0
4-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-F-Ph)-5-Pyr	0
4-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
4-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
4-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
4-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
4-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
4-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
4-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0096】

* * 【表5】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
5-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	Ph	0
5-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Np	0
5-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Np	0
5-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Me-Ph	0
5-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Et-Ph	0
5-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-iPr-Ph	0
5-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-iPr-Ph	0
5-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-tBu-Ph	0
5-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-tBu-Ph	0
5-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-F-Ph	0
5-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-F-Ph	0
5-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Cl-Ph	0

(76)

149

150

5-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Br-Ph	0
5-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-Ph	0
5-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
5-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-BzO-Ph	0
5-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Bz-Ph	0
5-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-PhO-Ph	0
5-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-PhO-Ph	0
5-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-PhS-Ph	0
5-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-PhS-Ph	0
5-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-PhSO ₂ -Ph	0
5-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-PhSO ₂ -Ph	0
5-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Imid-1)-Ph	0
5-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Imid-1)-Ph	0
5-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Imid-4)-Ph	0
5-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Imid-4)-Ph	0
5-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Fur-2)-Ph	0
5-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Fur-2)-Ph	0
5-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Thi-2)-Ph	0
5-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Thi-2)-Ph	0
5-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Thi-3)-Ph	0
5-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Thi-3)-Ph	0
5-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Pyr-2)-Ph	0
5-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
5-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Pyr-3)-Ph	0
5-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
5-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Pyr-4)-Ph	0
5-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0
5-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Oxa-2)-Ph	0
5-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Oxa-2)-Ph	0
5-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Oxa-4)-Ph	0
5-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Oxa-4)-Ph	0
5-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Oxa-5)-Ph	0
5-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Oxa-5)-Ph	0
5-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Thiz-2)-Ph	0
5-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Thiz-2)-Ph	0
5-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Thiz-4)-Ph	0
5-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Thiz-4)-Ph	0
5-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(Thiz-5)-Ph	0
5-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Thiz-5)-Ph	0
5-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-2-Pyrr	0
5-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Ph-2-Pyrr	0
5-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Bz-2-Pyrr	0
5-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Me-2-Fur	0
5-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Ph-2-Fur	0
5-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Me-2-Thi	0
5-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Ph-2-Thi	0
5-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Me-3-Thi	0
5-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Ph-3-Thi	0
5-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-3-Pyza	0
5-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Ph-3-Pyza	0

(77)

151

152

5-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-2-Imid	0
5-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Ph-2-Imid	0
5-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-4-Imid	0
5-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Ph-4-Imid	0
5-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Oxa	0
5-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Oxa	0
5-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-4-Oxa	0
5-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-4-Oxa	0
5-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Oxa	0
5-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Oxa	0
5-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
5-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
5-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Thiz	0
5-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Thiz	0
5-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-4-Thiz	0
5-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-4-Thiz	0
5-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Thiz	0
5-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Thiz	0
5-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
5-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
5-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-4-Pyza	0
5-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Ph-4-Pyza	0
5-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-4-Islox	0
5-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-4-Islox	0
5-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	0
5-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	0
5-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	0
5-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Me-5-Pyr	0
5-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Et-5-Pyr	0
5-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-5-Pyr	0
5-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	0
5-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-BzO-5-Pyr	0
5-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0
5-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	0
5-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	0
5-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	0
5-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	0
5-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	0
5-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
5-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
5-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
5-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
5-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Bz-5-Pyr	0
5-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhO-5-Pyr	0
5-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhS-5-Pyr	0
5-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
5-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Me-6-Pyr	0
5-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0
5-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-6-Pyr	0
5-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-6-Pyr	0

(78)

153								154
5-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-4-Pym	0
5-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-4-Pym	0
5-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-4-Pym	0
5-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-4-Pym	0
5-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-4-Pym	0
5-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-4-Pym	0
5-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-4-Pym	0
5-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrS-4-Pym	0
5-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	6-MeS-4-Pym	0
5-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	6-EtS-4-Pym	0
5-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	6-iPrS-4-Pym	0
5-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhS-4-Pym	0
5-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
5-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
5-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
5-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
5-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pym	0
5-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pym	0
5-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pym	0
5-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pym	0
5-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pym	0
5-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pym	0
5-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pym	0
5-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrS-5-Pym	0
5-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhS-5-Pym	0
5-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
5-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
5-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
5-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
5-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ind	0
5-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ind	0
5-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-2-Ind	0
5-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-3-Ind	0
5-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Bimid	0
5-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Boxa	0
5-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Bthiz	0
5-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Quin	0
5-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Quin	0
5-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Quin	0
5-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-iQuin	0
5-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-iQuin	0
5-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-iQuin	0
5-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-MeO-Ph	0
5-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-MeO-Ph	0
5-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-EtO-Ph	0
5-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-EtO-Ph	0
5-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-iPrO-Ph	0
5-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-iPrO-Ph	0
5-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-MeS-Ph	0
5-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-MeS-Ph	0

(79)

155						156		
5-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-EtS-Ph	0
5-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-EtS-Ph	0
5-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-iPrS-Ph	0
5-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-iPrS-Ph	0
5-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-MeSO ₂ -Ph	0
5-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-MeSO ₂ -Ph	0
5-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-EtSO ₂ -Ph	0
5-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-EtSO ₂ -Ph	0
5-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-iPrSO ₂ -Ph	0
5-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-iPrSO ₂ -Ph	0
5-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
5-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
5-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1-Me-2-Ph-4-Imid	0
5-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1,4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
5-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	1,5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
5-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3,4-MdO-Ph	0
5-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
5-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(3,4-MdO-Ph)-Ph	0
5-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0
5-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
5-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
5-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph	0
5-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0
5-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0
5-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
5-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph	0
5-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
5-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(4-F-Ph)-Ph	0
5-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
5-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0
5-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-HO-5-Pyr	0
5-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-BzO-5-Pyr	0
5-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0
5-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
5-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
5-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-HO-Ph	0
5-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-HO-Ph	0
5-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-HO-4,6-di-Me-Ph	0
5-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-HO-3,5-di-Me-Ph	0
5-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-AcO-Ph	0
5-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-AcO-Ph	0

【0097】

* * 【表6】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
6-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	Ph	0
6-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	soCH ₂	PhO	1-Np	0

(80)

157

158

6-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Np	0
6-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Me-Ph	0
6-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Et-Ph	0
6-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-iPr-Ph	0
6-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-iPr-Ph	0
6-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-tBu-Ph	0
6-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-tBu-Ph	0
6-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-F-Ph	0
6-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-F-Ph	0
6-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	4-Cl-Ph	0
6-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Br-Ph	0
6-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-Ph	0
6-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
6-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-BzO-Ph	0
6-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Bz-Ph	0
6-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-PhO-Ph	0
6-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-PhO-Ph	0
6-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-PhS-Ph	0
6-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-PhS-Ph	0
6-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	PhO	3-PhSO ₂ -Ph	0
6-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-PhSO ₂ -Ph	0
6-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Imid-1)-Ph	0
6-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Imid-1)-Ph	0
6-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Imid-4)-Ph	0
6-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Imid-4)-Ph	0
6-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Fur-2)-Ph	0
6-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Fur-2)-Ph	0
6-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Thi-2)-Ph	0
6-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Thi-2)-Ph	0
6-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	PhO	3-(Thi-3)-Ph	0
6-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Thi-3)-Ph	0
6-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Pyr-2)-Ph	0
6-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
6-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Pyr-3)-Ph	0
6-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
6-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Pyr-4)-Ph	0
6-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
6-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Oxa-2)-Ph	0
6-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Oxa-2)-Ph	0
6-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	PhO	3-(Oxa-4)-Ph	0
6-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Oxa-4)-Ph	0
6-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Oxa-5)-Ph	0
6-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Oxa-5)-Ph	0
6-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Thiz-2)-Ph	0
6-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Thiz-2)-Ph	0
6-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Thiz-4)-Ph	0
6-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Thiz-4)-Ph	0
6-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(Thiz-5)-Ph	0
6-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Thiz-5)-Ph	0
6-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	PhO	1-Me-2-Pyrr	0

(81)

159

160

6-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Ph-2-Pyrr	0
6-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Bz-2-Pyrr	0
6-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Me-2-Fur	0
6-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Ph-2-Fur	0
6-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Me-2-Thi	0
6-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Ph-2-Thi	0
6-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Me-3-Thi	0
6-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Ph-3-Thi	0
6-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-3-Pyza	0
6-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	1-Ph-3-Pyza	0
6-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-2-Imid	0
6-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Ph-2-Imid	0
6-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-4-Imid	0
6-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Ph-4-Imid	0
6-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Oxa	0
6-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Oxa	0
6-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-4-Oxa	0
6-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-4-Oxa	0
6-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Oxa	0
6-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	PhO	2-Ph-5-Oxa	0
6-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
6-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
6-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Thiz	0
6-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	5-Thiz	0
6-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-4-Thiz	0
6-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-4-Thiz	0
6-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Thiz	0
6-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Thiz	0
6-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
6-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	PhO	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
6-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-4-Pyza	0
6-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Ph-4-Pyza	0
6-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-4-Islox	0
6-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-4-Islox	0
6-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	0
6-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	0
6-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	0
6-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Me-5-Pyr	0
6-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Et-5-Pyr	0
6-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	PhO	3-Ph-5-Pyr	0
6-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	0
6-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-BzO-5-Pyr	0
6-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
6-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	0
6-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	0
6-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
6-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	0
6-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	0
6-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
6-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	PhO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0

(82)

161						162		
6-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
6-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
6-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Bz-5-Pyr	0
6-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhO-5-Pyr	0
6-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhS-5-Pyr	0
6-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
6-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Me-6-Pyr	0
6-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0
6-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-6-Pyr	0
6-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	2-Ph-6-Pyr	0
6-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-4-Pym	0
6-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-4-Pym	0
6-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-4-Pym	0
6-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-4-Pym	0
6-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-4-Pym	0
6-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-4-Pym	0
6-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-4-Pym	0
6-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrS-4-Pym	0
6-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	6-MeS-4-Pym	0
6-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	PhO	6-EtS-4-Pym	0
6-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	6-iPrS-4-Pym	0
6-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhS-4-Pym	0
6-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
6-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
6-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
6-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
6-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pym	0
6-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pym	0
6-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pym	0
6-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pym	0
6-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pym	0
6-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pym	0
6-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pym	0
6-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrS-5-Pym	0
6-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhS-5-Pym	0
6-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
6-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
6-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
6-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
6-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	PhO	2-Ind	0
6-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ind	0
6-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-2-Ind	0
6-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-3-Ind	0
6-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Bimid	0
6-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Boxa	0
6-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Bthiz	0
6-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Quin	0
6-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Quin	0
6-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Quin	0
6-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	PhO	1-iQuin	0

(83)

163						164		
6-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-iQuin	0
6-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-iQuin	0
6-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-MeO-Ph	0
6-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-MeO-Ph	0
6-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-EtO-Ph	0
6-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-EtO-Ph	0
6-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-iPrO-Ph	0
6-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-iPrO-Ph	0
6-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-MeS-Ph	0
6-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	4-MeS-Ph	0
6-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-EtS-Ph	0
6-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-EtS-Ph	0
6-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-iPrS-Ph	0
6-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-iPrS-Ph	0
6-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-MeSO ₂ -Ph	0
6-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-MeSO ₂ -Ph	0
6-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-EtSO ₂ -Ph	0
6-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-EtSO ₂ -Ph	0
6-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-iPrSO ₂ -Ph	0
6-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	PhO	4-iPrSO ₂ -Ph	0
6-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
6-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
6-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1-Me-2-Ph-4-Imid	0
6-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1, 4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
6-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	1, 5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
6-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3, 4-MdO-Ph	0
6-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
6-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	PhO	4-(3, 4-MdO-Ph)-Ph	0
6-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0
6-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-3)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
6-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
6-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]-Ph	0
6-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0
6-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0
6-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-2)SO ₂ N(Me)]-Ph	0
6-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	PhO	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]-Ph	0
6-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
6-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
6-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
6-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0
6-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-HO-5-Pyr	0
6-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-BzO-5-Pyr	0
6-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0
6-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
6-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
6-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	PhO	3-HO-Ph	0

(84)

165						166		
6-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-HO-Ph	0
6-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-HO-4, 6-di-Me-Ph	0
6-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-HO-3, 5-di-Me-Ph	0
6-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-AcO-Ph	0
6-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-AcO-Ph	0
6-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
6-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
6-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
6-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
6-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
6-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
6-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
6-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
6-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
6-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
6-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
6-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0
6-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
6-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	²⁰ CH ₂	PhO	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
6-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
6-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
6-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
6-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
6-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
6-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
6-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
6-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
6-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
6-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	³⁰ CH ₂	PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
6-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
6-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pip-Ph	0
6-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Dea-Ph	0
6-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
6-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
6-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
6-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
6-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
6-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
6-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	PhO	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
6-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
6-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
6-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
6-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
6-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
6-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
6-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
6-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
6-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0

(85)

167						168		
6-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-F-Ph)-5-Pyr	0
6-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
6-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
6-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
6-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
6-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
6-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
6-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0098】

* 10 * 【表7】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
7-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	0
7-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Np	0
7-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Np	0
7-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Me-Ph	0
7-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Et-Ph	0
7-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-iPr-Ph	0
7-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-iPr-Ph	0
7-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-tBu-Ph	0
7-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-tBu-Ph	0
7-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-F-Ph	0
7-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-F-Ph	0
7-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Cl-Ph	0
7-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Br-Ph	0
7-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-Ph	0
7-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
7-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-BzO-Ph	0
7-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Bz-Ph	0
7-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-PhO-Ph	0
7-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-PhO-Ph	0
7-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-PhS-Ph	0
7-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-PhS-Ph	0
7-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-PhSO ₂ -Ph	0
7-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-PhSO ₂ -Ph	0
7-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Imid-1)-Ph	0
7-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Imid-1)-Ph	0
7-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Imid-4)-Ph	0
7-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Imid-4)-Ph	0
7-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Fur-2)-Ph	0
7-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Fur-2)-Ph	0
7-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Thi-2)-Ph	0
7-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Thi-2)-Ph	0
7-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Thi-3)-Ph	0
7-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Thi-3)-Ph	0
7-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Pyr-2)-Ph	0
7-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(86)

169						170		
7-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Pyr-3)-Ph	0
7-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
7-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Pyr-4)-Ph	0
7-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
7-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Oxa-2)-Ph	0
7-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Oxa-2)-Ph	0
7-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Oxa-4)-Ph	0
7-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Oxa-4)-Ph	0
7-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Oxa-5)-Ph	0
7-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Oxa-5)-Ph	0
7-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Thiz-2)-Ph	0
7-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Thiz-2)-Ph	0
7-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Thiz-4)-Ph	0
7-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Thiz-4)-Ph	0
7-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(Thiz-5)-Ph	0
7-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Thiz-5)-Ph	0
7-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-2-Pyrr	0
7-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Ph-2-Pyrr	0
7-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Bz-2-Pyrr	0
7-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Me-2-Fur	0
7-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Ph-2-Fur	0
7-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Me-2-Thi	0
7-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Ph-2-Thi	0
7-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Me-3-Thi	0
7-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Ph-3-Thi	0
7-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-3-Pyza	0
7-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Ph-3-Pyza	0
7-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-2-Imid	0
7-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Ph-2-Imid	0
7-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-4-Imid	0
7-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Ph-4-Imid	0
7-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Oxa	0
7-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Oxa	0
7-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-4-Oxa	0
7-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-4-Oxa	0
7-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Oxa	0
7-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Oxa	0
7-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
7-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
7-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Thiz	0
7-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Thiz	0
7-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-4-Thiz	0
7-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-4-Thiz	0
7-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Thiz	0
7-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Thiz	0
7-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0

(87)

171						172		
7-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
7-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-4-Pyza	0
7-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Ph-4-Pyza	0
7-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-4-Isox	0
7-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-4-Isox	0
7-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	0
7-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	0
7-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	0
7-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Me-5-Pyr	0
7-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Et-5-Pyr	0
7-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-5-Pyr	0
7-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	0
7-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-BzO-5-Pyr	0
7-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
7-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
7-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
7-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
7-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
7-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
7-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
7-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
7-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
7-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
7-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Bz-5-Pyr	0
7-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhO-5-Pyr	0
7-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhS-5-Pyr	0
7-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
7-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Me-6-Pyr	0
7-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	0
7-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-6-Pyr	0
7-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-6-Pyr	0
7-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-4-Pym	0
7-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-4-Pym	0
7-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-4-Pym	0
7-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-4-Pym	0
7-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-4-Pym	0
7-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-4-Pym	0
7-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-4-Pym	0
7-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrS-4-Pym	0
7-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	6-MeS-4-Pym	0
7-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	6-EtS-4-Pym	0
7-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	6-iPrS-4-Pym	0
7-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhS-4-Pym	0
7-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
7-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
7-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
7-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhSO ₂ -4-Pym	0

(88)

173					174				
7-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pym	0	
7-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pym	0	
7-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pym	0	
7-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pym	0	
7-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pym	0	
7-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pym	0	
7-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pym	0	
7-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrS-5-Pym	0	
7-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhS-5-Pym	0	
7-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeSO ₂ -5-Pym	0	
7-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtSO ₂ -5-Pym	0	
7-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0	
7-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-PhSO ₂ -5-Pym	0	
7-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ind	0	
7-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ind	0	
7-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-2-Ind	0	
7-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-Me-3-Ind	0	
7-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Bimid	0	
7-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Boxa	0	
7-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Bthiz	0	
7-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Quin	0	
7-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Quin	0	
7-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Quin	0	
7-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1-iQuin	0	
7-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-iQuin	0	
7-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-iQuin	0	
7-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-MeO-Ph	0	
7-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-MeO-Ph	0	
7-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-EtO-Ph	0	
7-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-EtO-Ph	0	
7-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-iPrO-Ph	0	
7-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-iPrO-Ph	0	
7-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-MeS-Ph	0	
7-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-MeS-Ph	0	
7-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-EtS-Ph	0	
7-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-EtS-Ph	0	
7-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-iPrS-Ph	0	
7-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-iPrS-Ph	0	
7-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-MeSO ₂ -Ph	0	
7-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-MeSO ₂ -Ph	0	
7-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-EtSO ₂ -Ph	0	
7-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-EtSO ₂ -Ph	0	
7-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-iPrSO ₂ -Ph	0	
7-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-iPrSO ₂ -Ph	0	
7-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0	
7-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0	
7-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Me-2-Ph-4-Imid	0	
7-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	1,4-di-Me-2-Ph	0	

(89)

175

176

7-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	5-Imid 1, 5-di-Me-2-Ph- O
7-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Imid 3, 4-MdO-Ph O
7-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-MeO-Ph)- O Ph
7-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3, 4-MdO-Ph)- O Ph
7-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[PhSO ₂ N(Me)]- O Ph
7-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-3)- O SO ₂ N(Me)]-Ph
7-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(PhSO ₂ NH)-Ph O
7-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-3)- O SO ₂ NH]-Ph
7-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-2)SO ₂]- O Ph
7-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-3)SO ₂]- O Ph
7-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-2)- O SO ₂ N(Me)]-Ph
7-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-2)- O SO ₂ NH]-Ph
7-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph O
7-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph O
7-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)- O Ph
7-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-[PhSO ₂ N(Me)]- O 5-Pyr
7-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-HO-5-Pyr O
7-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-BzO-5-Pyr O
7-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-4)SO ₂]- O Ph
7-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-4)O]- O Ph
7-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-[(Pyr-4)S]- O Ph
7-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-HO-Ph O
7-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-HO-Ph O
7-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	HO-4, 6-di-Me- O Ph
7-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-HO-3, 5-di-Me- O Ph
7-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-AcO-Ph O
7-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-AcO-Ph O
7-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph O
7-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-HO-3, 5-di- O Me-Ph)-Ph
7-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph O
7-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-OHC-Ph)- O

(90)

177

178

7-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(4-Dmam-Ph)-	0
7-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(4-Dma-Ph)-	0
7-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(4-HOOC-Ph)-	0
7-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(4-HOH ₂ C-Ph)-	0
7-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-MeO-Ph)-	0
7-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-HO-Ph)-Ph	0
7-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-OHC-Ph)-	0
7-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-Dmam-Ph)-	0
7-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-Dma-Ph)-	0
7-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-HOOC-Ph)-	0
7-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-HOH ₂ C-Ph)-	0
7-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(2-MeO-Ph)-	0
7-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(2-HO-Ph)-Ph	0
7-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(2-OHC-Ph)-	0
7-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-MeO-Pyr-6)-	0
7-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-EtO-Pyr-6)-	0
7-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-iPrO-Pyr-6)-	0
7-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-Dma-Pyr-6)-	0
7-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-Dea-Pyr-6)-	0
7-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-	0
7-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-	0
7-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-Pip-Ph	0
7-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 4-Dea-Ph	0
7-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
7-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
7-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
7-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph 2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0

(91)

179

180

7-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Pyr 2-(4-iPrO-Ph)-5 O -Pyr
7-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-TfpO-5-Pyr O
7-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-AcO-Ph)- O Ph
7-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-F-Ph)-Ph O
7-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph O
7-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph O
7-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-AcO-Ph)- O Ph
7-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)- O Ph
7-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)- O Ph
7-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-Me-Ph)-5- O Pyr
7-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5- O Pyr
7-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5- O Pyr
7-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-F-Ph)-5- O Pyr
7-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Cl-Ph)-5- O Pyr
7-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-MeO-Ph)-5- O Pyr
7-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-EtO-Ph)-5- O Pyr
7-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5 O -Pyr
7-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Me-Ph)-5- O Pyr
7-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5- O Pyr
7-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Dma-Ph)-5- O Pyr

【0099】

* * 【表8】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
8-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	O
8-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Np	O
8-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Np	O
8-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Me-Ph	O
8-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Et-Ph	O
8-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-iPr-Ph	O

(92)

181						182		
8-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-iPr-Ph	0
8-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-tBu-Ph	0
8-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-tBu-Ph	0
8-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-F-Ph	0
8-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-F-Ph	0
8-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Cl-Ph	0
8-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Br-Ph	0
8-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-Ph	0
8-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
8-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-BzO-Ph	0
8-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Bz-Ph	0
8-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-PhO-Ph	0
8-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-PhO-Ph	0
8-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-PhS-Ph	0
8-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-PhS-Ph	0
8-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-PhSO ₂ -Ph	0
8-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-PhSO ₂ -Ph	0
8-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Imid-1)-Ph	0
8-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Imid-1)-Ph	0
8-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Imid-4)-Ph	0
8-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Imid-4)-Ph	0
8-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Fur-2)-Ph	0
8-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Fur-2)-Ph	0
8-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Thi-2)-Ph	0
8-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Thi-2)-Ph	0
8-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Thi-3)-Ph	0
8-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Thi-3)-Ph	0
8-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Pyr-2)-Ph	0
8-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
8-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Pyr-3)-Ph	0
8-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
8-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Pyr-4)-Ph	0
8-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
8-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Oxa-2)-Ph	0
8-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Oxa-2)-Ph	0
8-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Oxa-4)-Ph	0
8-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Oxa-4)-Ph	0
8-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Oxa-5)-Ph	0
8-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Oxa-5)-Ph	0
8-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Thiz-2)-Ph	0
8-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Thiz-2)-Ph	0
8-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Thiz-4)-Ph	0
8-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Thiz-4)-Ph	0
8-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(Thiz-5)-Ph	0
8-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Thiz-5)-Ph	0
8-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-2-Pyrr	0
8-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Ph-2-Pyrr	0
8-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Bz-2-Pyrr	0
8-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Me-2-Fur	0
8-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Ph-2-Fur	0

(93)

183						184		
8-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Me-2-Thi	0
8-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Ph-2-Thi	0
8-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Me-3-Thi	0
8-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Ph-3-Thi	0
8-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-3-Pyza	0
8-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Ph-3-Pyza	0
8-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-2-Imid	0
8-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Ph-2-Imid	0
8-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-4-Imid	0
8-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Ph-4-Imid	0
8-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Oxa	0
8-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Oxa	0
8-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-4-Oxa	0
8-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-4-Oxa	0
8-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Oxa	0
8-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Oxa	0
8-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
8-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
8-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Thiz	0
8-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Thiz	0
8-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-4-Thiz	0
8-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-4-Thiz	0
8-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Thiz	0
8-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Thiz	0
8-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Me-2-Ph-5-Thiz	0
8-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
8-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-4-Pyza	0
8-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Ph-4-Pyza	0
8-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-4-Isox	0
8-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-4-Isox	0
8-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	0
8-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	0
8-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	0
8-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Me-5-Pyr	0
8-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Et-5-Pyr	0
8-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-5-Pyr	0
8-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	0
8-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-BzO-5-Pyr	0
8-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
8-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
8-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
8-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
8-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
8-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
8-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
8-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0

(94)

185						186		
8-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
8-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
8-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Bz-5-Pyr	0
8-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhO-5-Pyr	0
8-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhS-5-Pyr	0
8-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
8-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Me-6-Pyr	0
8-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	0
8-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-6-Pyr	0
8-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-6-Pyr	0
8-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-4-Pym	0
8-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-4-Pym	0
8-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-4-Pym	0
8-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-4-Pym	0
8-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-4-Pym	0
8-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-4-Pym	0
8-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-4-Pym	0
8-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrS-4-Pym	0
8-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	6-MeS-4-Pym	0
8-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	6-EtS-4-Pym	0
8-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	6-iPrS-4-Pym	0
8-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhS-4-Pym	0
8-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
8-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
8-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
8-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
8-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pym	0
8-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pym	0
8-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pym	0
8-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pym	0
8-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pym	0
8-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pym	0
8-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pym	0
8-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrS-5-Pym	0
8-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhS-5-Pym	0
8-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
8-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtSO ₂ -5-Pym	0
8-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
8-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
8-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ind	0
8-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ind	0
8-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-2-Ind	0
8-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-Me-3-Ind	0
8-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Bimid	0
8-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Boxa	0
8-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Bthiz	0
8-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Quin	0
8-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Quin	0
8-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Quin	0

(95)

187

188

8-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1-iQuin	0
8-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-iQuin	0
8-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-iQuin	0
8-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-MeO-Ph	0
8-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-MeO-Ph	0
8-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-EtO-Ph	0
8-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-EtO-Ph	0
8-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-iPrO-Ph	0
8-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-iPrO-Ph	0
8-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-MeS-Ph	0
8-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-MeS-Ph	0
8-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-EtS-Ph	0
8-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-EtS-Ph	0
8-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-iPrS-Ph	0
8-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-iPrS-Ph	0
8-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-MeSO ₂ -Ph	0
8-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-MeSO ₂ -Ph	0
8-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-EtSO ₂ -Ph	0
8-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-EtSO ₂ -Ph	0
8-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-iPrSO ₂ -Ph	0
8-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-iPrSO ₂ -Ph	0
8-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
8-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
8-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Me-2-Ph-4-Imid	0
8-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1, 4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
8-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	1, 5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
8-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3, 4-MdO-Ph	0
8-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
8-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3, 4-MdO-Ph)-Ph	0
8-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0
8-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-3)-SO ₂ N(Me)]-Ph	0
8-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
8-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-3)-SO ₂ NH]-Ph	0
8-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-2)SO ₂]-Ph	0
8-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-3)SO ₂]-Ph	0
8-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-2)-SO ₂ N(Me)]-Ph	0
8-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-2)-SO ₂ NH]-Ph	0

(96)

189						190		
8-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
8-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
8-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
8-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5-Pyr	0
8-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-HO-5-Pyr	0
8-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-BzO-5-Pyr	0
8-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-4)SO ₂]-Ph	0
8-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
8-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
8-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-HO-Ph	0
8-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-HO-Ph	0
8-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	HO-4,6-di-Me-Ph	0
8-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-HO-3,5-di-Me-Ph	0
8-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-AcO-Ph	0
8-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-AcO-Ph	0
8-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
8-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-3,5-di-Me-Ph)-Ph	0
8-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
8-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
8-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
8-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
8-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
8-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
8-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
8-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
8-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
8-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0
8-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
8-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
8-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
8-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0

(97)

191

192

8-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
8-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(2-OHC-Ph)-	0
8-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-MeO-Pyr-6)	0
8-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-EtO-Pyr-6)	0
8-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-iPrO-Pyr-6)	0
8-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Dma-Pyr-6)	0
8-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Dea-Pyr-6)	0
8-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)	0
8-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)	0
8-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-Pip-Ph	0
8-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-Dea-Ph	0
8-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-F-Ph)-5-	0
8-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-Cl-Ph)-5-	0
8-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-MeO-Ph)-5-	0
8-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-EtO-Ph)-5-	0
8-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-iPrO-Ph)-5-	0
8-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-TfpO-5-Pyr	0
8-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(4-AcO-Ph)-	0
8-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-F-Ph)-Ph	0
8-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
8-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
8-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-AcO-Ph)-	0
8-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Me-Pyr-6)-	0
8-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	4-(3-Et-Pyr-6)-	0
8-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-Me-Ph)-5-	0
8-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-	0
8-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(4-Dma-Ph)-5-	0
8-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	2-(3-F-Ph)-5-	0

(98)

193						194		
8-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
8-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
8-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
8-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
8-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
8-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
8-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0100】

* * 【表 9】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
20								
9-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	0
9-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Np	0
9-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Np	0
9-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Me-Ph	0
9-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Et-Ph	0
9-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-iPr-Ph	0
9-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-iPr-Ph	0
9-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-tBu-Ph	0
9-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-tBu-Ph	0
9-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-F-Ph	0
9-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-F-Ph	0
9-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Cl-Ph	0
9-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Br-Ph	0
9-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-Ph	0
9-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
9-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-BzO-Ph	0
9-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Bz-Ph	0
9-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-PhO-Ph	0
9-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-PhO-Ph	0
9-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-PhS-Ph	0
9-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-PhS-Ph	0
9-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-PhSO ₂ -Ph	0
9-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-PhSO ₂ -Ph	0
9-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Imid-1)-Ph	0
9-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Imid-1)-Ph	0
9-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Imid-4)-Ph	0
9-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Imid-4)-Ph	0
9-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Fur-2)-Ph	0
9-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Fur-2)-Ph	0

(99)

195						196		
9-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Thi-2)-Ph	0
9-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Thi-2)-Ph	0
9-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Thi-3)-Ph	0
9-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Thi-3)-Ph	0
9-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Pyr-2)-Ph	0
9-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
9-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Pyr-3)-Ph	0
9-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0
9-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Pyr-4)-Ph	0
9-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0
9-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Oxa-2)-Ph	0
9-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Oxa-2)-Ph	0
9-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Oxa-4)-Ph	0
9-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Oxa-4)-Ph	0
9-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Oxa-5)-Ph	0
9-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Oxa-5)-Ph	0
9-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Thiz-2)-Ph	0
9-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Thiz-2)-Ph	0
9-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Thiz-4)-Ph	0
9-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Thiz-4)-Ph	0
9-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(Thiz-5)-Ph	0
9-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Thiz-5)-Ph	0
9-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-2-Pyrr	0
9-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Ph-2-Pyrr	0
9-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Bz-2-Pyrr	0
9-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Me-2-Fur	0
9-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Ph-2-Fur	0
9-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Me-2-Thi	0
9-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Ph-2-Thi	0
9-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Me-3-Thi	0
9-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Ph-3-Thi	0
9-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-3-Pyza	0
9-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Ph-3-Pyza	0
9-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-2-Imid	0
9-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Ph-2-Imid	0
9-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-4-Imid	0
9-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Ph-4-Imid	0
9-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Oxa	0
9-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Oxa	0
9-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-4-Oxa	0
9-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-4-Oxa	0
9-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Oxa	0
9-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Oxa	0
9-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
9-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
9-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Thiz	0
9-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Thiz	0
9-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-4-Thiz	0

(100)

197						198		
9-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-4-Thiz	0
9-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Thiz	0
9-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Thiz	0
9-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Me-2-Ph-5-Thiz	0
9-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	5-Me-2-Ph-4-Thiz	0
9-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-4-Pyza	0
9-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Ph-4-Pyza	0
9-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-4-Islox	0
9-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-4-Islox	0
9-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	0
9-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	0
9-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	0
9-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Me-5-Pyr	0
9-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Et-5-Pyr	0
9-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-5-Pyr	0
9-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	0
9-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-BzO-5-Pyr	0
9-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
9-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	0
9-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	0
9-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	0
9-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	0
9-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	0
9-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
9-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
9-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
9-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
9-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Bz-5-Pyr	0
9-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhO-5-Pyr	0
9-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhS-5-Pyr	0
9-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
9-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Me-6-Pyr	0
9-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0
9-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-6-Pyr	0
9-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-6-Pyr	0
9-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-4-Pym	0
9-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-4-Pym	0
9-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-4-Pym	0
9-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-4-Pym	0
9-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-4-Pym	0
9-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-4-Pym	0
9-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-4-Pym	0
9-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrS-4-Pym	0
9-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	6-MeS-4-Pym	0
9-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	6-EtS-4-Pym	0
9-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	6-iPrS-4-Pym	0

(101)

199				200			
9-124	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhS-4-Pym	0	
9-125	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeSO ₂ -4-Pym	0	
9-126	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtSO ₂ -4-Pym	0	
9-127	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0	
9-128	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhSO ₂ -4-Pym	0	
9-129	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pym	0	
9-130	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pym	0	
9-131	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pym	0	
9-132	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pym	0	
9-133	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pym	0	
9-134	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pym	0	
9-135	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pym	0	
9-136	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrS-5-Pym	0	
9-137	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhS-5-Pym	0	
9-138	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeSO ₂ -5-Pym	0	
9-139	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtSO ₂ -5-Pym	0	
9-140	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0	
9-141	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-PhSO ₂ -5-Pym	0	
9-142	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ind	0	
9-143	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ind	0	
9-144	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-2-Ind	0	
9-145	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-Me-3-Ind	0	
9-146	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Bimid	0	
9-147	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Boxa	0	
9-148	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Bthiz	0	
9-149	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Quin	0	
9-150	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Quin	0	
9-151	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Quin	0	
9-152	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	1-iQuin	0	
9-153	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-iQuin	0	
9-154	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-iQuin	0	
9-155	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-MeO-Ph	0	
9-156	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-MeO-Ph	0	
9-157	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-EtO-Ph	0	
9-158	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-EtO-Ph	0	
9-159	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-iPrO-Ph	0	
9-160	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-iPrO-Ph	0	
9-161	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-MeS-Ph	0	
9-162	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-MeS-Ph	0	
9-163	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-EtS-Ph	0	
9-164	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-EtS-Ph	0	
9-165	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-iPrS-Ph	0	
9-166	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-iPrS-Ph	0	
9-167	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-MeSO ₂ -Ph	0	
9-168	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-MeSO ₂ -Ph	0	
9-169	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-EtSO ₂ -Ph	0	
9-170	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-EtSO ₂ -Ph	0	
9-171	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-iPrSO ₂ -Ph	0	
9-172	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-iPrSO ₂ -Ph	0	
9-173	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-(1-Me-Imid-4)-	0	

(102)

201						202		
9-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	Ph 4-(1-Me-Imid-4)-	0
9-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	Ph Me-2-Ph-4- Imid	0
9-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	1,4-di-Me-2-Ph-5- Imid	0
9-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	1,5-di-Me-2-Ph-4- Imid	0
9-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	3,4-MdO-Ph	0
9-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(4-MeO-Ph)- Ph	0
9-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(3,4-MdO- Ph)-Ph	0
9-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[PhSO ₂ N(Me)]- Ph	0
9-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-3) SO ₂ N(Me)]-Ph	0
9-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
9-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-3)SO ₂ NH]- Ph	0
9-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-2)SO ₂]- Ph	0
9-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-3)SO ₂]- Ph	0
9-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-2) SO ₂ N(Me)]-Ph	0
9-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-2)SO ₂ NH]- Ph	0
9-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
9-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(4-F-Ph)-Ph	0
9-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-(4-CF ₃ -Ph)- Ph	0
9-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5- Pyr	0
9-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	2-HO-5-Pyr	0
9-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	2-BzO-5-Pyr	0
9-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-4)SO ₂]- Ph	0
9-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-4)O]- Ph	0
9-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-[(Pyr-4)S]- Ph	0
9-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	3-HO-Ph	0
9-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	4-HO-Ph	0
9-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	HO-4,6-di-Me- Ph	0
9-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	HO-3,5-di-Me- Ph	0
9-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph (CH ₂) ₃	3-AcO-Ph	0

(103)

203							204	
9-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-AcO-Ph	0

【0101】

* * 【表 10】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
10-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	Ph	0
10-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Np	0
10-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Np	0
10-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Me-Ph	0
10-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Et-Ph	0
10-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-iPr-Ph	0
10-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-iPr-Ph	0
10-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-tBu-Ph	0
10-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-tBu-Ph	0
10-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-F-Ph	0
10-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-F-Ph	0
10-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Cl-Ph	0
10-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Br-Ph	0
10-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Ph-Ph	0
10-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Ph-Ph	0
10-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-BzO-Ph	0
10-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Bz-Ph	0
10-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-PhO-Ph	0
10-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-PhO-Ph	0
10-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-PhS-Ph	0
10-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-PhS-Ph	0
10-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-PhSO ₂ -Ph	0
10-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-PhSO ₂ -Ph	0
10-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Imid-1)-Ph	0
10-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Imid-1)-Ph	0
10-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Imid-4)-Ph	0
10-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Imid-4)-Ph	0
10-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Fur-2)-Ph	0
10-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Fur-2)-Ph	0
10-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Thi-2)-Ph	0
10-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Thi-2)-Ph	0
10-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Thi-3)-Ph	0
10-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Thi-3)-Ph	0
10-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Pyr-2)-Ph	0
10-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Pyr-2)-Ph	0
10-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Pyr-3)-Ph	0
10-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Pyr-3)-Ph	0
10-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Pyr-4)-Ph	0
10-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Pyr-4)-Ph	0
10-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Oxa-2)-Ph	0
10-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Oxa-2)-Ph	0
10-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CiO ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Oxa-4)-Ph	0

(104)

205						206		
10-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Oxa-4)-Ph	0
10-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Oxa-5)-Ph	0
10-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Oxa-5)-Ph	0
10-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Thiz-2)-Ph	0
10-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Thiz-2)-Ph	0
10-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Thiz-4)-Ph	0
10-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Thiz-4)-Ph	0
10-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(Thiz-5)-Ph	0
10-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(Thiz-5)-Ph	0
10-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	Ci ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-2-Pyrr	0
10-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Ph-2-Pyrr	0
10-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Bz-2-Pyrr	0
10-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Me-2-Fur	0
10-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Ph-2-Fur	0
10-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Me-2-Thi	0
10-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Ph-2-Thi	0
10-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Me-3-Thi	0
10-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Ph-3-Thi	0
10-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-3-Pyza	0
10-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₂ ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Ph-3-Pyza	0
10-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-2-Imid	0
10-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Ph-2-Imid	0
10-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-4-Imid	0
10-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Ph-4-Imid	0
10-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Oxa	0
10-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Oxa	0
10-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-4-Oxa	0
10-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-4-Oxa	0
10-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-5-Oxa	0
10-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₃ ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-5-Oxa	0
10-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Me-2-Ph-5-Oxa	0
10-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Me-2-Ph-4-Oxa	0
10-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Thiz	0
10-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	5-Thiz	0
10-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-4-Thiz	0
10-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-4-Thiz	0
10-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-5-Thiz	0
10-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-5-Thiz	0
10-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	Me-2-Ph-5-Thiz	0
10-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	Me-2-Ph-4-Thiz	0
10-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-4-Pyza	0
10-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Ph-4-Pyza	0
10-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-4-Isox	0
10-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-4-Isox	0
10-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Pyr	0
10-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Pyr	0
10-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Pyr	0
10-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	C ₅ ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Me-5-Pyr	0

(105)

207

208

10-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Et-5-Pyr	0
10-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Ph-5-Pyr	0
10-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-5-Pyr	0
10-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-BzO-5-Pyr	0
10-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-5-Pyr	0
10-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeO-5-Pyr	0
10-97	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtO-5-Pyr	0
10-98	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrO-5-Pyr	0
10-99	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeS-5-Pyr	0
10-100	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtS-5-Pyr	0
10-101	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhSO ₂ NH-5-Pyr	0
10-102	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
10-103	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
10-104	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhSO ₂ NMe-5-Pyr	0
10-105	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Bz-5-Pyr	0
10-106	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhO-5-Pyr	0
10-107	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhS-5-Pyr	0
10-108	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
10-109	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Me-6-Pyr	0
10-110	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Ph-6-Pyr	0
10-111	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-6-Pyr	0
10-112	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-6-Pyr	0
10-113	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-4-Pym	0
10-114	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-4-Pym	0
10-115	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeO-4-Pym	0
10-116	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtO-4-Pym	0
10-117	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrO-4-Pym	0
10-118	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeS-4-Pym	0
10-119	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtS-4-Pym	0
10-120	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrS-4-Pym	0
10-121	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	6-MeS-4-Pym	0
10-122	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	6-EtS-4-Pym	0
10-123	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	6-iPrS-4-Pym	0
10-124	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhS-4-Pym	0
10-125	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeSO ₂ -4-Pym	0
10-126	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtSO ₂ -4-Pym	0
10-127	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrSO ₂ -4-Pym	0
10-128	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhSO ₂ -4-Pym	0
10-129	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Me-5-Pym	0
10-130	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ph-5-Pym	0
10-131	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeO-5-Pym	0
10-132	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtO-5-Pym	0
10-133	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrO-5-Pym	0
10-134	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeS-5-Pym	0
10-135	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtS-5-Pym	0
10-136	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrS-5-Pym	0
10-137	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhS-5-Pym	0
10-138	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-MeSO ₂ -5-Pym	0
10-139	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-EtSO ₂ -5-Pym	0

(106)

209

210

10-140	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-iPrSO ₂ -5-Pym	0
10-141	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-PhSO ₂ -5-Pym	0
10-142	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Ind	0
10-143	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Ind	0
10-144	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-2-Ind	0
10-145	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-Me-3-Ind	0
10-146	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Bimid	0
10-147	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Boxa	0
10-148	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Bthiz	0
10-149	H	(CH ₂) ₂	H	H	Ciö ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-Quin	0
10-150	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-Quin	0
10-151	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-Quin	0
10-152	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1-iQuin	0
10-153	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-iQuin	0
10-154	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-iQuin	0
10-155	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-MeO-Ph	0
10-156	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-MeO-Ph	0
10-157	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-EtO-Ph	0
10-158	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-EtO-Ph	0
10-159	H	(CH ₂) ₂	H	H	Cäö ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-iPrO-Ph	0
10-160	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-iPrO-Ph	0
10-161	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-MeS-Ph	0
10-162	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-MeS-Ph	0
10-163	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-EtS-Ph	0
10-164	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-EtS-Ph	0
10-165	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-iPrS-Ph	0
10-166	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-iPrS-Ph	0
10-167	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-MeSO ₂ -Ph	0
10-168	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-MeSO ₂ -Ph	0
10-169	H	(CH ₂) ₂	H	H	Cäö ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-EtSO ₂ -Ph	0
10-170	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-EtSO ₂ -Ph	0
10-171	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-iPrSO ₂ -Ph	0
10-172	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-iPrSO ₂ -Ph	0
10-173	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
10-174	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(1-Me-Imid-4)-Ph	0
10-175	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	Me-2-Ph-4-Imid	0
10-176	H	(CH ₂) ₂	H	H	Cäö ₂	Ph(CH ₂) ₄	1,4-di-Me-2-Ph-5-Imid	0
10-177	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	1,5-di-Me-2-Ph-4-Imid	0
10-178	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3,4-MdO-Ph	0
10-179	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
10-180	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(3,4-MdO-Ph)-Ph	0
10-181	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[PhSO ₂ N(Me)]-Ph	0
10-182	H	(CH ₂) ₂	H	H	Cäö ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[Pyr-3]	0

(107)

211

212

							SO ₂ N(Me)]-Ph	
10-183	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(PhSO ₂ NH)-Ph	0
10-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-3) SO ₂ NH]-Ph	0
10-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-2)SO ₂]- Ph	0
10-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-3)SO ₂]- Ph	0
10-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-2) SO ₂ N(Me)]-Ph	0
10-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-2) SO ₂ NH]-Ph	0
10-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
10-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(4-F-Ph)-Ph	0
10-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
10-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-[PhSO ₂ N(Me)]-5 -Pyr	0
10-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-HO-5-Pyr	0
10-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	2-BzO-5-Pyr	0
10-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-4)SO ₂]- Ph	0
10-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-4)O]-Ph	0
10-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-[(Pyr-4)S]-Ph	0
10-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-HO-Ph	0
10-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-HO-Ph	0
10-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	HO-3, 4, 6- tri-Me-Ph	0
10-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-HO-3, 5-di-Me- Ph	0
10-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	3-AcO-Ph	0
10-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₄	4-AcO-Ph	0

【0102】

* * 【表11】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
11-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	Ph	0
11-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-Me-Ph	0
11-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-F-Ph	0
11-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-Bz-Ph	0
11-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-Ph-Ph	0
11-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-PhO-Ph	0
11-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-PhS-Ph	0
11-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-PhSO ₂ -Ph	0
11-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
11-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
11-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)-Ph	0
11-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-3)-Ph	0

(108)

213						214		
11-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)-Ph	0
11-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)O-Ph	0
11-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)O-Ph	0
11-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)S-Ph	0
11-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)S-Ph	0
11-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0
11-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
11-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)SO ₂ NH-Ph	0
11-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)SO ₂ NH-Ph	0
11-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe-Ph	0
11-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe-Ph	0
11-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-Pyr	0
11-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	3-Pyr	0
11-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	4-Pyr	0
11-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-Me-5-Pyr	0
11-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-Me-3-Pyr	0
11-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-MeO-5-Pyr	0
11-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-EtO-5-Pyr	0
11-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-iPrO-5-Pyr	0
11-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-MeS-5-Pyr	0
11-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-EtS-5-Pyr	0
11-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
11-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
11-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-Bz-5-Pyr	0
11-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-Ph-5-Pyr	0
11-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	3-Ph-6-Pyr	0
11-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-PhO-5-Pyr	0
11-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-PhS-5-Pyr	0
11-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0

【0103】

* * 【表12】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
12-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	Ph	0
12-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Me-Ph	0
12-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-F-Ph	0
12-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Bz-Ph	0
12-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
12-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-PhO-Ph	0
12-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-PhS-Ph	0
12-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-PhSO ₂ -Ph	0
12-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
12-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
12-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
12-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0
12-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
12-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)O-Ph	0

(109)

215						216		
12-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)O-Ph	0
12-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)S-Ph	0
12-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)S-Ph	0
12-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0
12-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
12-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)SO ₂ NH-Ph	0
12-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)SO ₂ NH-Ph	0
12-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe-Ph	0
12-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe-Ph	0
12-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	0
12-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	0
12-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	0
12-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	0
12-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	0
12-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	0
12-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	0
12-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	0
12-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	0
12-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	0
12-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
12-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
12-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Bz-5-Pyr	0
12-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0
12-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0
12-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-PhO-5-Pyr	0
12-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-PhS-5-Pyr	0
12-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0

【0104】

* * 【表13】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
13-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	Ph	0
13-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-Me-Ph	0
13-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-F-Ph	0
13-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-Bz-Ph	0
13-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-Ph-Ph	0
13-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-PhO-Ph	0
13-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-PhS-Ph	0
13-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-PhSO ₂ -Ph	0
13-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
13-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
13-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)-Ph	0
13-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-3)-Ph	0
13-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)-Ph	0
13-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)O-Ph	0
13-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)O-Ph	0
13-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)S-Ph	0

(110)

217						218		
13-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)S-Ph	0
13-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0
13-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
13-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)SO ₂ NH-Ph	0
13-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)SO ₂ NH-Ph	0
13-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe-Ph	0
13-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe-Ph	0
13-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-Pyr	0
13-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	3-Pyr	0
13-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	4-Pyr	0
13-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-Me-5-Pyr	0
13-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-Me-3-Pyr	0
13-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-MeO-5-Pyr	0
13-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-EtO-5-Pyr	0
13-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-iPrO-5-Pyr	0
13-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-MeS-5-Pyr	0
13-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-EtS-5-Pyr	0
13-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
13-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
13-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-Bz-5-Pyr	0
13-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-Ph-5-Pyr	0
13-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	3-Ph-6-Pyr	0
13-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-PhO-5-Pyr	0
13-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-PhS-5-Pyr	0
13-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtS	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0

【0105】

* * 【表14】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z 30	W	X	Y
14-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph	0
14-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Me-Ph	0
14-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-F-Ph	0
14-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Bz-Ph	0
14-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
14-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-PhO-Ph	0
14-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-PhS-Ph	0
14-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-PhSO ₂ -Ph	0
14-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
14-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
14-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
14-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
14-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
14-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)O-Ph	0
14-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)O-Ph	0
14-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)S-Ph	0
14-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)S-Ph	0
14-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0

(111)

219						220		
14-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
14-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)SO ₂ NH- Ph	0
14-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)SO ₂ NH- Ph	0
14-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe- Ph	0
14-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe- Ph	0
14-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-Pyr	0
14-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	3-Pyr	0
14-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Pyr	0
14-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-Me-5-Pyr	0
14-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-Me-3-Pyr	0
14-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
14-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
14-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
14-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
14-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
14-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
14-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
14-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-Bz-5-Pyr	0
14-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
14-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	3-Ph-6-Pyr	0
14-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-PhO-5-Pyr	0
14-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-PhS-5-Pyr	0
14-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
14-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
14-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
14-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
14-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
14-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-HO-3, 5-di- Me-Ph)-Ph	0
14-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
14-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
14-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
14-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-Dmam-Ph)- Ph	0
14-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
14-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-HOOC-Ph)- Ph	0
14-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-HOH ₂ C-Ph)- Ph	0
14-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
14-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
14-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
14-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dmam-Ph)- Ph	0
14-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
14-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-HOOC-Ph)-	0

(112)

221

222

14-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-HOH ₂ C-Ph)-	0
14-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
14-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
14-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
14-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-	0
14-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-EtO-Pyr-6)-	0
14-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-iPrO-Pyr-6)	0
14-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	-Ph 4-(3-Dma-Pyr-6)-	0
14-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-Dea-Pyr-6)-	0
14-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-	0
14-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-O ₂ N-Pyr-3)-	0
14-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-Pip-Ph	0
14-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Dea-Ph	0
14-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-	0
14-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-Cl-Ph)-5-	0
14-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-MeO-Ph)-5-	0
14-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-EtO-Ph)-5-	0
14-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-iPrO-Ph)-5-	0
14-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-TfpO-5-Pyr	0
14-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
14-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
14-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
14-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
14-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
14-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-	0
14-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 4-(3-Et-Pyr-6)-	0
14-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Ph 2-(4-Me-Ph)-5-	0
14-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-CF ₃ -Ph)-5-	0
14-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(4-Dma-Ph)-5-	0
14-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	Pyr 2-(3-F-Ph)-5-	0

(113)

223							224	
14-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
14-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
14-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
14-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
14-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
14-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
14-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0106】

* * 【表15】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					20			
15-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	Ph	0
15-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-Me-Ph	0
15-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-F-Ph	0
15-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-Bz-Ph	0
15-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-Ph-Ph	0
15-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-PhO-Ph	0
15-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-PhS-Ph	0
15-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-PhSO ₂ -Ph	0
15-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
15-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
15-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)-Ph	0
15-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-3)-Ph	0
15-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)-Ph	0
15-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)O-Ph	0
15-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)O-Ph	0
15-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)S-Ph	0
15-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)S-Ph	0
15-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0
15-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
15-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)SO ₂ NH-Ph	0
15-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)SO ₂ NH-Ph	0
15-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe-Ph	0
15-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe-Ph	0
15-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-Pyr	0
15-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	3-Pyr	0

(114)

225						226		
15-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	4-Pyr	0
15-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-Me-5-Pyr	0
15-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-Me-3-Pyr	0
15-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-MeO-5-Pyr	0
15-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-EtO-5-Pyr	0
15-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-iPrO-5-Pyr	0
15-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-MeS-5-Pyr	0
15-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-EtS-5-Pyr	0
15-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
15-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
15-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-Bz-5-Pyr	0
15-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-Ph-5-Pyr	0
15-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	3-Ph-6-Pyr	0
15-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-PhO-5-Pyr	0
15-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-PhS-5-Pyr	0
15-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-Ph	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
15-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
15-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
15-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
15-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
15-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
15-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
15-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
15-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
15-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
15-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
15-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
15-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
15-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
15-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
15-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
15-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0
15-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
15-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
15-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
15-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
15-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
15-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
15-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
15-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
15-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0

(115)

227

228

15-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	-Ph 4-(3-Dma-Pyr-6)-	0
15-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Ph 4-(3-Dea-Pyr-6)-	0
15-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Ph 4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-	0
15-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Ph 4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-	0
15-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-Pip-Ph	0
15-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-Dea-Ph	0
15-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	2-(4-F-Ph)-5-	0
15-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-Cl-Ph)-5-	0
15-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-MeO-Ph)-5-	0
15-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-EtO-Ph)-5-	0
15-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-iPrO-Ph)-5-	0
15-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
15-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
15-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
15-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
15-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
15-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
15-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-	0
15-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Ph 4-(3-Et-Pyr-6)-	0
15-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Ph 2-(4-Me-Ph)-5-	0
15-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-CF ₃ -Ph)-5-	0
15-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(4-Dma-Ph)-5-	0
15-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-F-Ph)-5-	0
15-90	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-Cl-Ph)-5-	0
15-91	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-MeO-Ph)-5-	0
15-92	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-EtO-Ph)-5-	0
15-93	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-iPrO-Ph)-5-	0
15-94	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-Me-Ph)-5-	0
15-95	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-CF ₃ -Ph)-5-	0

(116)

229

230

15-96	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Et-PhO	Pyr 2-(3-Dma-Ph)-5- Pyr	O
-------	---	---------------------------------	---	---	-----------------	----------	-------------------------------	---

【0107】

* * 【表16】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
16-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	Ph	O
16-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-Me-Ph	O
16-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-F-Ph	O
16-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-Bz-Ph	O
16-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-Ph-Ph	O
16-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-PhO-Ph	O
16-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-PhS-Ph	O
16-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-PhSO ₂ -Ph	O
16-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-PhSO ₂ NH-Ph	O
16-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-PhSO ₂ NMe-Ph	O
16-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)-Ph	O
16-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-3)-Ph	O
16-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)-Ph	O
16-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)O-Ph	O
16-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)O-Ph	O
16-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)S-Ph	O
16-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)S-Ph	O
16-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	O
16-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	O
16-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)SO ₂ NH- Ph	O
16-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)SO ₂ NH- Ph	O
16-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe- Ph	O
16-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe- Ph	O
16-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-Pyr	O
16-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	3-Pyr	O
16-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	4-Pyr	O
16-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-Me-5-Pyr	O
16-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-Me-3-Pyr	O
16-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-MeO-5-Pyr	O
16-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-EtO-5-Pyr	O
16-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-iPrO-5-Pyr	O
16-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-MeS-5-Pyr	O
16-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-EtS-5-Pyr	O
16-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-MeSO ₂ -5-Pyr	O
16-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-EtSO ₂ -5-Pyr	O
16-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-Bz-5-Pyr	O

(117)

231					232			
16-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-Ph-5-Pyr	0
16-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	3-Ph-6-Pyr	0
16-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-PhO-5-Pyr	0
16-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-PhS-5-Pyr	0
16-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₂	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0

【0108】

* * 【表17】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z 10	W	X	Y
17-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	Ph	0
17-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Me-Ph	0
17-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-F-Ph	0
17-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Bz-Ph	0
17-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
17-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-PhO-Ph	0
17-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-PhS-Ph	0
17-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-PhSO ₂ -Ph	0
17-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-PhSO ₂ NH-Ph	0
17-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-PhSO ₂ NMe-Ph	0
17-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
17-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0
17-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
17-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)O-Ph	0
17-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)O-Ph	0
17-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)S-Ph	0
17-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)S-Ph	0
17-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)SO ₂ -Ph	0
17-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)SO ₂ -Ph	0
17-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)SO ₂ NH-Ph	0
17-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)SO ₂ NH-Ph	0
17-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)SO ₂ NMe-Ph	0
17-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)SO ₂ NMe-Ph	0
17-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	0
17-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	0
17-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	0
17-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	0
17-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	0
17-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	0
17-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	0
17-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	0
17-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	0
17-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	0
17-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeSO ₂ -5-Pyr	0
17-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtSO ₂ -5-Pyr	0
17-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Bz-5-Pyr	0
17-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
17-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

(118)

233						234		
17-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-PhO-5-Pyr	0
17-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-PhS-5-Pyr	0
17-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-PhSO ₂ -5-Pyr	0
17-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
17-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
17-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-F-Ph)-Ph	0
17-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
17-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
17-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
17-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
17-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
17-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-Dmam-Ph)-Ph	0
17-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
17-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-HOOC-Ph)-Ph	0
17-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(4-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
17-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
17-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
17-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-OHC-Ph)-Ph	0
17-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-Dmam-Ph)-Ph	0
17-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
17-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-HOOC-Ph)-Ph	0
17-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-HOH ₂ C-Ph)-Ph	0
17-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
17-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
17-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(2-OHC-Ph)-Ph	0
17-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
17-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
17-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
17-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
17-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
17-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
17-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
17-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pip-Ph	0
17-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Dea-Ph	0
17-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
17-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
17-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
17-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
17-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
17-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-TfpO-5-Pyr	0

【0109】

* * 【表 18】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
18-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	Ph	0
18-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0

(119)

235								236
18-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
18-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
18-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
18-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	0
18-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	0
18-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	0
18-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	0
18-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	0
18-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	0
18-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H ¹⁰	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	0
18-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	0
18-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	0
18-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	0
18-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	0
18-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	0

【0110】

* * 【表19】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴ 20	Z	W	X	Y
19-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	Ph	0
19-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
19-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
19-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
19-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
19-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	0
19-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	0
19-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H ³⁰	CH ₂	Pr	4-Pyr	0
19-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	0
19-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	0
19-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	0
19-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	0
19-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	0
19-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	0
19-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	0
19-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	0
19-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	0

【0111】

※ ※ 【表20】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
20-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	Ph	0
20-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
20-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H ⁵⁰	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0

(120)

237						238		
20-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	0
20-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	0
20-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	0
20-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	0
20-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	0
20-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	0
20-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	0
20-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	0
20-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H ¹⁰	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	0
20-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	0
20-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
20-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0
20-18	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
20-19	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-F-Ph)-Ph	0
20-20	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
20-21	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
20-22	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
20-23	Me	(CH ₂) ₂	H	H ²⁰	CH ₂	Bu	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
20-24	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
20-25	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
20-26	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
20-27	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
20-28	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
20-29	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
20-30	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-31	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
20-32	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
20-33	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-34	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
20-35	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
20-36	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
20-37	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-38	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
20-39	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-40	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
20-41	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
20-42	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
20-43	Et	(CH ₂) ₂	H	H ⁵⁰	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0

(121)

239							240	
20-44	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-45	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
20-46	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-47	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-48	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-49	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-50	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-51	Et	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
20-52	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
20-53	Bu	(CH ₂) ₂	H	H ¹⁰	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-54	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
20-55	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-56	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-57	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-58	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-59	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-60	Bu	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
20-61	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
20-62	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-63	Bz	(CH ₂) ₂	H	H ²⁰	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
20-64	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-65	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-66	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-67	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-68	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-69	Bz	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
20-70	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
20-71	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-72	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
20-73	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H ³⁰	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-74	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-75	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-76	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-77	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-78	Ppr	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
20-79	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
20-80	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
20-81	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
20-82	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
20-83	Me	(CH ₂) ₃	H	H ⁴⁰	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
20-84	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
20-85	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
20-86	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
20-87	Me	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0

【0112】

* * 【表21】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(122)

241

242

21-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	Ph	0
21-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
21-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
21-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
21-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0
21-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	0
21-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	0
21-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	0
21-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	0
21-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	0
21-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	0
21-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	0
21-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	0
21-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	0
21-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	0
21-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0
21-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0

【0113】

* 20 * 【表 2 2】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
22-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	Ph	0
22-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
22-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
22-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0
22-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
22-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	0
22-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	0
22-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	0
22-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	0
22-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	0
22-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	0
22-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	0
22-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	0
22-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	0
22-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	0
22-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0
22-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0

【0114】

※ ※ 【表 2 3】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
23-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	Ph	0

(123)

243								244
23-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
23-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
23-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
23-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
23-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	0
23-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	0
23-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	0
23-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	0
23-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	0
23-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	0
23-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	0
23-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
23-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	0
23-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	0
23-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
23-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0115】

* * 【表 2 4】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
24-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	0
24-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
24-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
24-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
24-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
24-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	0
24-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	0
24-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	0
24-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	0
24-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	0
24-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
24-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
24-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
24-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
24-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
24-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
24-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0116】

※ ※ 【表 2 5】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
25-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	0
25-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
25-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(124)

245					246			
25-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
25-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
25-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	0
25-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	0
25-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	0
25-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	0
25-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	0
25-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
25-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
25-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
25-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
25-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
25-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
25-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0117】

* * 【表26】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					20			
26-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	Ph	0
26-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
26-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
26-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0
26-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
26-6	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	0
26-7	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	0
26-8	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	0
26-9	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	0
26-10	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	0
26-11	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	0
26-12	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	0
26-13	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	0
26-14	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	0
26-15	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	0
26-16	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
26-17	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

【0118】

※40※ 【表27】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
27-1	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	0
27-2	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
27-3	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
27-4	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0
27-5	Me	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0

(125)

247				248			
27-6	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	0
27-7	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	0
27-8	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	0
27-9	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	0
27-10	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	0
27-11	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	0
27-12	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	0
27-13	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	0
27-14	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	0
27-15	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	0
27-16	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
27-17	Me	(CH ₂) ₂	H H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0

【0119】

* * 【表28】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
28-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	Ph	0
28-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
28-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
28-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
28-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
28-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Pyr	0
28-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	3-Pyr	0
28-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-Pyr	0
28-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	0
28-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	0
28-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	0
28-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	0
28-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	0
28-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	0
28-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	0
28-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	0
28-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	0
28-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
28-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
28-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
28-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
28-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
28-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
28-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
28-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
28-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
28-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
28-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
28-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
28-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0

(126)

249						250		
28-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
28-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
28-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
28-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
28-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
28-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
28-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
28-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
28-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
28-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
28-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
28-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
28-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0120】

* * 【表29】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
29-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	Ph	0
29-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
29-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
29-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
29-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
29-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Pyr	0
29-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	3-Pyr	0
29-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-Pyr	0
29-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	0
29-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	0
29-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	0
29-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	0
29-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	0
29-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	0
29-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	0
29-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	0
29-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	0
29-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
29-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-F-Ph)-Ph	0
29-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
29-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)- Ph	0
29-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
29-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
29-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
29-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
29-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
29-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
29-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
29-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0

(127)

251								252	
29-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(2-HO-Ph)-Ph	0	
29-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
29-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0	
29-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0	
29-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
29-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0	
29-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0	
29-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
29-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
29-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	Cl ₂	Pr	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0	
29-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
29-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0	
29-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0	
29-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr	0	

【0121】

* * 【表30】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					20			
30-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	Ph	0
30-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
30-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
30-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
30-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
30-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-Pyr	0
30-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	3-Pyr	0
30-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-Pyr	0
30-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	Cl ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	0
30-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	0
30-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	0
30-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	0
30-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	0
30-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	0
30-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	0
30-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
30-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0
30-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
30-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	Cl ₂	Bu	4-(4-F-Ph)-Ph	0
30-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
30-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
30-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
30-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
30-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
30-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
30-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
30-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
30-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	Cl ₂	Bu	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0

(128)

253								254
30-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
30-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
30-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
30-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
30-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
30-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
30-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
30-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
30-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
30-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
30-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
30-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
30-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
30-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
30-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0

【0122】

* * 【表31】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z 20	W	X	Y
31-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	Ph	0
31-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
31-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
31-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
31-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0
31-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Pyr	0
31-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	3-Pyr	0
31-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-Pyr	0
31-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	0
31-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	0
31-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	0
31-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	0
31-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	0
31-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	0
31-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	0
31-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0
31-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0

【0123】

※ ※ 【表32】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
32-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	Ph	0
32-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
32-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
32-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0

(129)

255						256		
32-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
32-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Pyr	0
32-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	3-Pyr	0
32-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-Pyr	0
32-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	0
32-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	0
32-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	0
32-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	0
32-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	0
32-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	0
32-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	0
32-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0
32-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0

【 0 1 2 4 】

* * 【表 3 3】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
33-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	Ph	0
33-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
33-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
33-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
33-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
33-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-Pyr	0
33-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	3-Pyr	0
33-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-Pyr	0
33-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	0
33-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	0
33-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	0
33-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	0
33-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
33-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	0
33-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	0
33-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
33-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0
33-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
33-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
33-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
33-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
33-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
33-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
33-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
33-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
33-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
33-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
33-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
33-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0

(130)

257						258		
33-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
33-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
33-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
33-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
33-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
33-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
33-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
33-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
33-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
33-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
33-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
33-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
33-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
33-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
33-44	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(4-AcO-Ph)-Ph	0
33-45	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
33-46	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
33-47	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
33-48	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-AcO-Ph)-Ph	0
33-49	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
33-50	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
33-51	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
33-52	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
33-53	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0
33-54	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-F-Ph)-5-Pyr	0
33-55	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-Pyr	0
33-56	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-Pyr	0
33-57	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-Pyr	0
33-58	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
33-59	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-Me-Ph)-5-Pyr	0
33-60	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
33-61	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0125】

* * 【表 3 4】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
34-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	0
34-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
34-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
34-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
34-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
34-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	0
34-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	0
34-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	0
34-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	0
34-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	0

(131)

259						260		
34-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
34-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
34-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
34-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
34-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
34-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
34-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	0
34-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
34-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
34-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
34-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
34-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
34-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
34-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
34-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
34-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
34-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
34-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
34-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
34-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
34-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
34-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
34-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
34-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
34-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
34-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
34-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
34-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
34-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
34-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
34-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
34-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0

(132)

261

262

							-Pyr	
34-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
34-44	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(4-AcO-Ph)-	0
							Ph	
34-45	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
34-46	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
34-47	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
34-48	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-AcO-Ph)-	0
							Ph	
34-49	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-	0
							Ph	
34-50	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-	0
							Ph	
34-51	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-52	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-	0
							Pyr	
34-53	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-54	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	2-(3-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-55	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-56	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-57	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-58	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5	0
							-Pyr	
34-59	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Me-Ph)-5-	0
							Pyr	
34-60	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-	0
							Pyr	
34-61	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-	0
							Pyr	

【 0 1 2 6 】

* * 【表 3 5】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z 40	W	X	Y
35-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	0
35-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
35-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
35-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
35-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
35-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	0
35-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	0
35-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	ClO ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	0

(133)

263				264			
35-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr 0
35-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr 0
35-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr 0
35-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr 0
35-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr 0
35-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr 0
35-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr 0
35-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr 0
35-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr 0
35-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph 0
35-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph 0
35-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph 0
35-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph 0
35-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph 0
35-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph 0
35-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph 0
35-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph 0
35-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph 0
35-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph 0
35-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph 0
35-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph 0
35-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph 0
35-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph 0
35-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph 0
35-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph 0
35-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph 0
35-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph 0
35-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph 0
35-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph 0
35-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr 0
35-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr 0
35-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr 0
35-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr 0

(134)

265

266

							Pyr	
35-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5	0
							-Pyr	
35-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
35-44	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-AcO-Ph)-	0
							Ph	
35-45	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-F-Ph)-Ph	0
35-46	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Cl-Ph)-Ph	0
35-47	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Me-Ph)-Ph	0
35-48	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-AcO-Ph)-	0
							Ph	
35-49	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-	0
							Ph	
35-50	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-	0
							Ph	
35-51	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-52	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-	0
							Pyr	
35-53	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-54	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-55	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Cl-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-56	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-MeO-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-57	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-EtO-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-58	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-iPrO-Ph)-5	0
							-Pyr	
35-59	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Me-Ph)-5-	0
							Pyr	
35-60	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-CF ₃ -Ph)-5-	0
							Pyr	
35-61	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(3-Dma-Ph)-5-	0
							Pyr	

【0127】

* * 【表36】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
36-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	Ph	0
36-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
36-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
36-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0
36-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
36-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-Pyr	0

(135)

267							268	
36-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	3-Pyr	0
36-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-Pyr	0
36-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	0
36-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	0
36-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	0
36-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	0
36-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	0
36-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	0
36-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	0
36-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me ₁₀	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
36-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

【0128】

* * 【表37】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
37-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	0
37-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
37-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
37-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0
37-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0
37-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	0
37-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	0
37-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	0
37-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	0
37-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	0
37-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	0
37-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	0
37-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	0
37-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	0
37-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	0
37-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
37-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0

【0129】

※ ※ 【表38】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
38-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	Ph	0
38-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
38-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
38-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
38-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
38-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	0
38-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	0
38-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	0

(136)

269									270		
38-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr			0	
38-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr			0	
38-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr			0	
38-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr			0	
38-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr			0	
38-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr			0	
38-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr			0	
38-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr			0	
38-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr			0	
38-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	EtO	4-(4-Me-Ph)-Ph			0	
38-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-F-Ph)-Ph			0	
38-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Cl-Ph)-Ph			0	
38-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph			0	
38-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-MeO-Ph)-Ph			0	
38-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-HO-Ph)-Ph			0	
38-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-OHC-Ph)-Ph			0	
38-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(4-Dma-Ph)-Ph			0	
38-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Ph)-Ph			0	
38-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	EtO	4-(3-HO-Ph)-Ph			0	
38-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Ph)-Ph			0	
38-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(2-MeO-Ph)-Ph			0	
38-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(2-HO-Ph)-Ph			0	
38-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph			0	
38-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph			0	
38-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph			0	
38-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph			0	
38-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph			0	
38-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph			0	
38-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	EtO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph			0	
38-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr			0	
38-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr			0	
38-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr			0	
38-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr			0	
38-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr			0	
38-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr			0	

【0130】

* * 【表39】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
39-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	Ph	0
39-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
39-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
39-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
39-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
39-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	0
39-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	Pr	3-Pyr	0

(137)

271					272				
39-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr		0
39-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr		0
39-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr		0
39-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr		0
39-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr		0
39-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr		0
39-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr		0
39-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr		0
39-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr		0
39-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr		0
39-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
39-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-F-Ph)-Ph		0
39-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
39-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph		0
39-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
39-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
39-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-OHC-Ph)-Ph		0
39-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
39-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	Pr	4-(3-MeO-Ph)-Ph		0
39-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-HO-Ph)-Ph		0
39-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Ph)-Ph		0
39-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(2-MeO-Ph)-Ph		0
39-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(2-HO-Ph)-Ph		0
39-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
39-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
39-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph		0
39-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
39-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph		0
39-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	Pr	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph		0
39-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
39-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
39-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
39-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
39-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr		0
39-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr		0
39-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr		0

【0131】

* * 【表40】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
40-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	Ph	0
40-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
40-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
40-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
40-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
40-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	Bu	2-Pyr	0

(138)

273						274		
40-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	0
40-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	0
40-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	0
40-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	0
40-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	0
40-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	0
40-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	0
40-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	0
40-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	0
40-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	Ci ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
40-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0
40-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
40-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-F-Ph)-Ph	0
40-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
40-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
40-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
40-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
40-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
40-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	C ₂ ₂	Bu	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
40-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
40-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
40-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
40-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
40-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
40-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
40-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
40-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
40-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
40-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	C ₃ ₂	Bu	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
40-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
40-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
40-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
40-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
40-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
40-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
40-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
40-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0

【0132】

* 40 * 【表41】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
41-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	Ph	0
41-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
41-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
41-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
41-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	C ₅ ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0

(139)

275								276	
41-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	0	
41-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	0	
41-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	0	
41-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	0	
41-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	0	
41-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	0	
41-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	0	
41-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	0	
41-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	0	
41-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	0	
41-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0	
41-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0	

【0133】

* * 【表 4 2】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
42-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	Ph	0
42-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
42-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
42-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0
42-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
42-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	0
42-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	0
42-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	0
42-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	0
42-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	0
42-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	0
42-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	0
42-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	0
42-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	0
42-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	0
42-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0
42-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0

【0134】

※ ※ 【表 4 3】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
43-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	Ph	0
43-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
43-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
43-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
43-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
43-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	0
43-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	0

(140)

277						278		
43-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	0
43-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	0
43-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	0
43-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	0
43-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	0
43-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
43-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	0
43-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	0
43-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
43-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0
43-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
43-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
43-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
43-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
43-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
43-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
43-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
43-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
43-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	PhO	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
43-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
43-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
43-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
43-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
43-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
43-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
43-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
43-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
43-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
43-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
43-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
43-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
43-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
43-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
43-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
43-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
43-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【 0 1 3 5 】

* * 【 表 4 4 】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
44-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	0
44-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
44-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
44-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
44-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
44-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	0

(141)

279						280		
44-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	3-Pyr	0
44-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-Pyr	0
44-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-Me-5-Pyr	0
44-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-Me-3-Pyr	0
44-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-MeO-5-Pyr	0
44-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-EtO-5-Pyr	0
44-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-iPrO-5-Pyr	0
44-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-MeS-5-Pyr	0
44-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-EtS-5-Pyr	0
44-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	4-iPr-Ph0	2-Ph-5-Pyr	0
44-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	3-Ph-6-Pyr	0
44-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
44-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-F-Ph)-Ph	0
44-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
44-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-HO-3, 5-di-Me-Ph)-Ph	0
44-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
44-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
44-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-OHC-Ph)-Ph	0
44-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
44-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-MeO-Ph)-Ph	0
44-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
44-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-Dma-Ph)-Ph	0
44-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(2-MeO-Ph)-Ph	0
44-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(2-HO-Ph)-Ph	0
44-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
44-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
44-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-iPrO-Pyr-6)-Ph	0
44-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
44-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-Dea-Pyr-6)-Ph	0
44-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-Ph	0
44-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
44-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
44-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
44-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CiO ₂	4-iPr-Ph0	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0

(142)

281

282

44-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Pyr 2-(4-EtO-Ph)-5- O
44-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Pyr 2-(4-iPrO-Ph)-5 O
44-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	-Pyr 2-TfpO-5-Pyr 0

【 0 1 3 6 】

* * 【表 4 5】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
45-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	0
45-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
45-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
45-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
45-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
45-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	0
45-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	0
45-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	0
45-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	0
45-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	0
45-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
45-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
45-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
45-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
45-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
45-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
45-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	0
45-18	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph	0
45-19	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
45-20	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
45-21	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-3, 5- di-Me-Ph)-Ph	0
45-22	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-MeO-Ph)- Ph	0
45-23	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
45-24	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-OHC-Ph)- Ph	0
45-25	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(4-Dma-Ph)- Ph	0
45-26	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Ph)- Ph	0
45-27	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-HO-Ph)-Ph	0
45-28	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Ph)- Ph	0
45-29	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(2-MeO-Ph)- Ph	0
45-30	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(2-HO-Ph)-Ph	0

(143)

283						284		
45-31	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-O-Ph	0
45-32	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-O-Ph	0
45-33	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-iPrO-Pyr-6)-O-Ph	0
45-34	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-O-Ph	0
45-35	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dea-Pyr-6)-O-Ph	0
45-36	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-F ₃ C-Pyr-6)-O-Ph	0
45-37	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-O-Ph	0
45-38	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
45-39	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
45-40	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
45-41	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-EtO-Ph)-5-Pyr	0
45-42	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-iPrO-Ph)-5-Pyr	0
45-43	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0137】

* * 【表46】

例示化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					30			
46-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	Ph	0
46-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
46-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
46-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0
46-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
46-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	0
46-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	0
46-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	0
46-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	0
46-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	0
46-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	0
46-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	0
46-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	0
46-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	0
46-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	0
46-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
46-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

(144)

285

286

【0138】

* * 【表47】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
47-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	0
47-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
47-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
47-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0
47-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0
47-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	0
47-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	0
47-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	0
47-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	0
47-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	0
47-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	0
47-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	0
47-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	0
47-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	0
47-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	0
47-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
47-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0

【0139】

※ ※ 【表48】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
48-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	Ph	0
48-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
48-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
48-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
48-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
48-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	0
48-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	0
48-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	0
48-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	0
48-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	0
48-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	0
48-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	0
48-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	0
48-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	0
48-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	0
48-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	0
48-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	0

【0140】

★ ★ 【表49】

(145)

	287						288	
例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
49-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	Ph	0
49-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
49-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
49-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
49-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
49-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	0
49-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	0
49-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr	0
49-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	0
49-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	0
49-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	0
49-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	0
49-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	0
49-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	0
49-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	0
49-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	0
49-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	0

【0141】

* * 【表50】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
50-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	Ph	0
50-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
50-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
50-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
50-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
50-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	0
50-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	0
50-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	0
50-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	0
50-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	0
50-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	0
50-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	0
50-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	0
50-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	0
50-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	0
50-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
50-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0

【0142】

※ ※ 【表51】

例示 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(146)

289		290						
番号								
51-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	Ph	0
51-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
51-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
51-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
51-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0
51-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	0
51-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	0
51-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	0
51-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	0
51-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	0
51-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	0
51-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	0
51-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	0
51-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	0
51-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	0
51-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0
51-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0

【0143】

* * 【表 5 2】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
52-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	Ph	0
52-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
52-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
52-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0
52-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
52-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	0
52-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	0
52-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	0
52-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	0
52-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	0
52-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	0
52-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	0
52-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	0
52-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	0
52-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	0
52-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0
52-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0

【0144】

※ ※ 【表 5 3】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(147)

291					292			
53-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	Ph	0
53-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
53-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
53-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
53-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
53-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	0
53-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	0
53-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	0
53-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	0
53-10	H	CHMeCH ₂	H	H	¹⁰ CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	0
53-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	0
53-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	0
53-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
53-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	0
53-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	0
53-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
53-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0145】

* * 【表54】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
54-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	0
54-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
54-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
54-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
54-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
54-6	H	CHMeCH ₂	H	H	³⁰ CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	0
54-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	0
54-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	0
54-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	0
54-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	0
54-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
54-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
54-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
54-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
54-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
54-16	H	CHMeCH ₂	H	H	⁴⁰ CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
54-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0146】

※ ※ 【表55】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
55-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	0
55-2	H	CHMeCH ₂	H	H	⁵⁰ CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0

(148)

293						294		
55-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
55-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
55-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
55-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	0
55-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	0
55-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	0
55-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	0
55-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	0
55-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	0
55-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	0
55-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	0
55-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	0
55-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	0
55-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
55-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0147】

* * 【表56】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z 20	W	X	Y
56-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	Ph	0
56-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
56-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
56-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0
56-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
56-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	0
56-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	0
56-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	0
56-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	0
56-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	0
56-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	0
56-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	0
56-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	0
56-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	0
56-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	0
56-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
56-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

【0148】

※ ※ 【表57】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
57-1	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	0
57-2	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
57-3	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
57-4	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0

(149)

295						296		
57-5	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0
57-6	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	0
57-7	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	0
57-8	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	0
57-9	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	0
57-10	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	0
57-11	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	0
57-12	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	0
57-13	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	0
57-14	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	0
57-15	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	0
57-16	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
57-17	H	CHMeCH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0

【0149】

* * 【表 58】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
58-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	Ph	—
58-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	—
58-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	—
58-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	—
58-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	—
58-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	—
58-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	—
58-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	—
58-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	—
58-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	—
58-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	—
58-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	—
58-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	—
58-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	—
58-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	—
58-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	—
58-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	—

【0150】

※ ※ 【表 59】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
59-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	Ph	—
59-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	—
59-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	—
59-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	—
59-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	—
59-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	—

(150)

297								298
59-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	—
59-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr	—
59-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	—
59-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	—
59-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	—
59-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	—
59-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	—
59-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	—
59-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	—
59-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	—
59-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	—

【0151】

* * 【表60】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
60-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	Ph	—
60-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	—
60-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	—
60-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	—
60-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	—
60-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	—
60-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	—
60-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	—
60-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	—
60-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	—
60-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	—
60-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	—
60-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	—
60-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	—
60-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	—
60-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	—
60-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	—

【0152】

※ ※ 【表61】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
61-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	Ph	—
61-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	—
61-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	—
61-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	—
61-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	—
61-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	—
61-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	—
61-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	—

(151)

299							300	
61-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	—
61-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	—
61-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	—
61-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	—
61-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	—
61-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	—
61-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	—
61-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	—
61-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	—

【0153】

* * 【表62】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
62-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	Ph	—
62-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	—
62-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	—
62-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	—
62-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	—
62-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	—
62-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	—
62-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	—
62-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	—
62-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	—
62-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	—
62-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	—
62-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	—
62-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	—
62-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	—
62-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	—
62-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	—

【0154】

※ ※ 【表63】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
63-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	Ph	—
63-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	—
63-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
63-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
63-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
63-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	—
63-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	—
63-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	—
63-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	—
63-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	—

(152)

301							302	
63-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	—
63-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	—
63-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
63-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	—
63-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	—
63-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	—
63-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0155】

* * 【表64】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
64-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	—
64-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	—
64-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
64-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
64-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
64-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	—
64-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	—
64-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	—
64-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	—
64-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	—
64-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
64-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	—
64-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
64-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	—
64-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	—
64-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
64-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0156】

※ ※ 【表65】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
65-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	—
65-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	—
65-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
65-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
65-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
65-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	—
65-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	—
65-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	—
65-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	—
65-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	—
65-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
65-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	—

(153)

303						304	
65-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr —
65-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr —
65-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr —
65-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr —
65-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr —

【0157】

* * 【表66】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z ₁₀	W	X	Y
66-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	Ph	—
66-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	—
66-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	—
66-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	—
66-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	—
66-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	—
66-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	—
66-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	—
66-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	—
66-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	—
66-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	—
66-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	—
66-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	—
66-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	—
66-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	—
66-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	—
66-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	—

【0158】

※ ※ 【表67】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
67-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	—
67-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	—
67-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	—
67-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	—
67-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	—
67-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	—
67-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	—
67-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	—
67-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	—
67-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	—
67-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	—
67-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	—
67-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	—
67-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	—

(154)

	305						306	
67-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	—
67-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	—
67-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	—

【0159】

* * 【表68】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
68-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	Ph	—
68-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	—
68-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	—
68-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	—
68-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	—
68-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	—
68-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	—
68-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	—
68-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	—
68-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	—
68-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	—
68-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	—
68-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	—
68-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	—
68-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	—
68-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	—
68-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	—

【0160】

※ ※ 【表69】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
69-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	Ph	—
69-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	—
69-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	—
69-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	—
69-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	—
69-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	—
69-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	—
69-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr	—
69-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	—
69-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	—
69-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	—
69-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	—
69-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	—
69-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	—
69-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	—
69-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	—

(155)

307								308
69-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	—

【0161】

* * 【表70】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
70-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	Ph	—
70-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	—
70-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	—
70-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	—
70-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	—
70-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	—
70-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	—
70-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	—
70-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	—
70-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	—
70-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	—
70-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	—
70-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	—
70-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	—
70-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	—
70-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	—
70-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	—

【0162】

※ ※ 【表71】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					30			
71-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	Ph	—
71-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	—
71-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	—
71-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	—
71-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	—
71-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	—
71-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	—
71-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	—
71-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	—
71-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	—
71-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	—
71-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	—
71-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	—
71-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	—
71-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	—
71-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	—
71-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	—

(156)

309

310

【0163】

* * 【表72】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
72-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	Ph	—
72-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	—
72-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	—
72-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	—
72-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	—
72-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	—
72-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	—
72-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	—
72-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	—
72-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	—
72-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	—
72-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	—
72-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	—
72-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	—
72-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	—
72-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	—
72-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	—

【0164】

※ ※ 【表73】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
73-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	Ph	—
73-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	—
73-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
73-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
73-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
73-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	—
73-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	—
73-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	—
73-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	—
73-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	—
73-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	—
73-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	—
73-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
73-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	—
73-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	—
73-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	—
73-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0165】

★ ★ 【表74】

(157)

311							312	
例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
74-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	—
74-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	—
74-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
74-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
74-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
74-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	—
74-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	—
74-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	—
74-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	—
74-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	—
74-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
74-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	—
74-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
74-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	—
74-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	—
74-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
74-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0166】

* * 【表75】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
75-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	—
75-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	—
75-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
75-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
75-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
75-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	—
75-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	—
75-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	—
75-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	—
75-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	—
75-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
75-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	—
75-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
75-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	—
75-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	—
75-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
75-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0167】

※ ※ 【表76】

例示 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(158)

313

314

番号

76-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	Ph	—
76-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	—
76-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	—
76-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	—
76-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	—
76-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	—
76-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	—
76-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	—
76-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	—
76-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	—
76-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	—
76-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	—
76-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	—
76-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	—
76-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	—
76-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	—
76-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	—

【0168】

* * 【表77】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
77-1	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	—
77-2	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	—
77-3	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	—
77-4	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	—
77-5	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	—
77-6	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	—
77-7	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	—
77-8	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	—
77-9	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	—
77-10	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	—
77-11	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	—
77-12	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	—
77-13	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	—
77-14	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	—
77-15	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	—
77-16	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	—
77-17	H	(CH ₂) ₃	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	—

【0169】

※ ※ 【表78】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(159)

315								316
78-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	Ph	—
78-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	—
78-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	—
78-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	—
78-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	—
78-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Pyr	—
78-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Pyr	—
78-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Pyr	—
78-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-5-Pyr	—
78-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Me-3-Pyr	—
78-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeO-5-Pyr	—
78-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtO-5-Pyr	—
78-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-iPrO-5-Pyr	—
78-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-MeS-5-Pyr	—
78-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-EtS-5-Pyr	—
78-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	—
78-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	—

【0170】

* * 【表79】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
79-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	Ph	—
79-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	—
79-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	—
79-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	—
79-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	—
79-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Pyr	—
79-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Pyr	—
79-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Pyr	—
79-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-5-Pyr	—
79-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Me-3-Pyr	—
79-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeO-5-Pyr	—
79-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtO-5-Pyr	—
79-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-iPrO-5-Pyr	—
79-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-MeS-5-Pyr	—
79-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-EtS-5-Pyr	—
79-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	—
79-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	—

【0171】

※ ※ 【表80】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
80-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	Ph	—
80-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	—

(160)

317								318	
80-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	—	
80-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	—	
80-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	—	
80-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Pyr	—	
80-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Pyr	—	
80-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Pyr	—	
80-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-5-Pyr	—	
80-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Me-3-Pyr	—	
80-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeO-5-Pyr	—	
80-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtO-5-Pyr	—	
80-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-iPrO-5-Pyr	—	
80-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-MeS-5-Pyr	—	
80-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-EtS-5-Pyr	—	
80-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	—	
80-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	—	

【0172】

* * 【表81】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
20								
81-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	Ph	—
81-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	—
81-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	—
81-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	—
81-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	—
81-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Pyr	—
81-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Pyr	—
81-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Pyr	—
81-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-5-Pyr	—
81-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Me-3-Pyr	—
81-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeO-5-Pyr	—
81-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtO-5-Pyr	—
81-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-iPrO-5-Pyr	—
81-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-MeS-5-Pyr	—
81-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-EtS-5-Pyr	—
81-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	—
81-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	—

【0173】

※ ※ 【表82】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
82-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	Ph	—
82-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	—
82-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	—
82-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	—

(161)

319								320
82-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	—
82-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Pyr	—
82-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Pyr	—
82-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Pyr	—
82-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-5-Pyr	—
82-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Me-3-Pyr	—
82-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeO-5-Pyr	—
82-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtO-5-Pyr	—
82-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-iPrO-5-Pyr	—
82-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-MeS-5-Pyr	—
82-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-EtS-5-Pyr	—
82-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	—
82-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	—

【0174】

* * 【表83】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
83-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	Ph	—
83-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	—
83-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
83-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
83-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
83-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Pyr	—
83-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Pyr	—
83-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Pyr	—
83-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-5-Pyr	—
83-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Me-3-Pyr	—
83-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeO-5-Pyr	—
83-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtO-5-Pyr	—
83-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
83-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-MeS-5-Pyr	—
83-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-EtS-5-Pyr	—
83-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	—
83-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0175】

※ ※ 【表84】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
84-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	Ph	—
84-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	—
84-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
84-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
84-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
84-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Pyr	—

(162)

321						322		
84-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Pyr	—
84-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Pyr	—
84-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-5-Pyr	—
84-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Me-3-Pyr	—
84-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
84-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtO-5-Pyr	—
84-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
84-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-MeS-5-Pyr	—
84-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-EtS-5-Pyr	—
84-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
84-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0176】

* * 【表85】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
85-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	Ph	—
85-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	—
85-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
85-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
85-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
85-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Pyr	—
85-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Pyr	—
85-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Pyr	—
85-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-5-Pyr	—
85-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Me-3-Pyr	—
85-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeO-5-Pyr	—
85-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtO-5-Pyr	—
85-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-iPrO-5-Pyr	—
85-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-MeS-5-Pyr	—
85-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-EtS-5-Pyr	—
85-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
85-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0177】

※ ※ 【表86】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
86-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	Ph	—
86-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	—
86-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	—
86-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	—
86-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	—
86-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Pyr	—
86-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Pyr	—
86-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Pyr	—

(163)

323								324
86-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-5-Pyr	—
86-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Me-3-Pyr	—
86-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeO-5-Pyr	—
86-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtO-5-Pyr	—
86-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-iPrO-5-Pyr	—
86-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-MeS-5-Pyr	—
86-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-EtS-5-Pyr	—
86-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	—
86-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	—

【0178】

* * 【表87】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
87-1	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	Ph	—
87-2	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	—
87-3	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	—
87-4	H	CH ₂	H	H	CH ₂	²⁰ Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	—
87-5	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	—
87-6	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Pyr	—
87-7	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Pyr	—
87-8	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Pyr	—
87-9	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-5-Pyr	—
87-10	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Me-3-Pyr	—
87-11	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-MeO-5-Pyr	—
87-12	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtO-5-Pyr	—
87-13	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-iPrO-5-Pyr	—
87-14	H	CH ₂	H	H	CH ₂	³⁰ Ph(CH ₂) ₃	2-MeS-5-Pyr	—
87-15	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-EtS-5-Pyr	—
87-16	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	—
87-17	H	CH ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	—

【0179】

※ ※ 【表88】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
88-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	—
88-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	—
88-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	—
88-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	—
88-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	—
88-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	—

【0180】

★ ★ 【表89】

例示	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
----	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(164)

325

326

化合物
番号

89-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	—
89-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	—
89-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	—
89-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	—
89-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	—
89-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	—

【0181】

* * 【表90】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
90-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	—
90-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	—
90-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	—
90-4	H	CH ₂	H	Me	²⁰ CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	—
90-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	—
90-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	—

【0182】

※ ※ 【表91】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
91-1	H	CH ₂	H	Me	³⁰ CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	—
91-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	—
91-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	—
91-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	—
91-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	—
91-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	—

【0183】

★ ★ 【表92】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
92-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	—
92-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	—
92-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	—
92-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	—
92-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	—
92-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	—

【0184】

50 【表93】

(165)

327

328

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
93-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	—
93-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
93-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
93-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
93-5	H	CH ₂	H	Me	¹⁰ CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	—
93-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0185】

* * 【表94】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
94-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	—
94-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)- Ph	—
94-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)- Ph	—
94-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)- Ph	—
94-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
94-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0186】

※ ※ 【表95】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
95-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	—
95-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)- Ph	—
95-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)- Ph	—
95-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)- Ph	—
95-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
95-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0187】

★ ★ 【表96】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(166)

329						330		
96-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	—
96-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	—
96-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	—
96-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	—
96-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	—
96-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	—

【0188】

* * 【表 9 7】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
97-1	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	—
97-2	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)- Ph	—
97-3	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)- Ph	—
97-4	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)- Ph	—
97-5	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	—
97-6	H	CH ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	—

【0189】

※ ※ 【表 9 8】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
98-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me ³⁰	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	—
98-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	—
98-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	—
98-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	—
98-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	—
98-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	—

【0190】

★ ★ 【表 9 9】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
99-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	—
99-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	—
99-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	—
99-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	—
99-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	—
99-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	—

【0191】

50 【表 1 0 0】

(167)

331

332

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
100-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	—
100-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	—
100-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	—
100-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	—
100-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me ₁₀	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	—
100-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	—

【0192】

* * 【表101】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
101-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	—
101-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me ₂₀	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	—
101-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	—
101-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	—
101-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	—
101-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	—

【0193】

※ ※ 【表102】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
				30				
102-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	—
102-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	—
102-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	—
102-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	—
102-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	—
102-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	—

【0194】

★ ★ 【表103】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
103-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph0	4-Ph-Ph	—
103-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph0	4-(Pyr-2)-Ph	—
103-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph0	4-(Pyr-3)-Ph	—
103-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph0	4-(Pyr-4)-Ph	—
103-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph0	2-Ph-5-Pyr	—
103-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me ₃₀	CH ₂	Ph0	3-Ph-6-Pyr	—

(168)

333

334

【0195】

* * 【表104】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
104-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	—
104-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
104-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
104-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
104-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
104-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0196】

※ ※ 【表105】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
105-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	—
105-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	—
105-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	—
105-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	—
105-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	—
105-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	—

【0197】

★ ★ 【表106】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
106-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	—
106-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	—
106-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	—
106-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	—
106-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	—
106-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	—

【0198】

☆ ☆ 【表107】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
107-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	—
107-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	—
107-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	—
107-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	—

(169)

335							336	
107-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	—
107-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	—

【0199】

* * 【表108】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
108-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	S
108-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	S
108-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	S
108-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	S
108-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	S
108-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	S

【0200】

※ ※ 【表109】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					20			
109-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	S
109-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	S
109-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	S
109-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	S
109-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	S
109-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	S

【0201】

★₃₀★ 【表110】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
110-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	S
110-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	S
110-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	S
110-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	S
110-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	S
110-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	S

【0202】

☆ ☆ 【表111】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
111-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	S
111-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	S

(170)

337						338		
111-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	S
111-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	S
111-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	S
111-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	S

【0203】

* * 【表112】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
10								
112-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	S
112-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	S
112-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	S
112-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	S
112-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	S
112-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	S

【0204】

※ ※ 【表113】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
113-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	S
113-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	S
113-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	S
113-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	S
113-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	S
113-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	S

【0205】

★ ★ 【表114】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
114-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	S
114-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	S
114-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	S
114-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	S
114-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	S
114-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	S

【0206】

☆ ☆ 【表115】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(171)

339						340		
115-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	S
115-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	S
115-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	S
115-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	S
115-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	S
115-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	S

【0207】

* * 【表 1 1 6】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
116-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	S
116-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	S
116-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	S
116-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	S
116-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	S
116-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	S

【0208】

※ ※ 【表 1 1 7】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
117-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	S
117-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	S
117-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	S
117-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ³⁰	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	S
117-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	S
117-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	S

【0209】

★ ★ 【表 1 1 8】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
118-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	NMe
118-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
118-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
118-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
118-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	NMe
118-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0210】

☆ ☆ 【表 1 1 9】

例示 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(172)

341

342

番号

119-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	NMe
119-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
119-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
119-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
119-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	NMe
119-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0211】

* 10 * 【表 1 2 0】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
120-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	NMe
120-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
120-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
120-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
120-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	NMe
120-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0212】

※ ※ 【表 1 2 1】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
121-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	NMe
121-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
121-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
121-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
121-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	NMe
121-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0213】

★ ★ 【表 1 2 2】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
122-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	NMe
122-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
122-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
122-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
122-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	NMe
122-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0214】

☆ ☆ 【表 1 2 3】

(173)

343							344	
例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
123-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	NMe
123-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
123-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
123-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
123-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	NMe
123-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	Ciô ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0215】

* * 【表124】

例示	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
化合物								
番号								
124-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	NMe
124-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
124-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
124-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
124-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	NMe
124-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0216】

※ ※ 【表125】

例示	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
化合物								
番号								
125-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	NMe
125-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
125-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
125-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
125-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	NMe
125-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0217】

★ ★ 【表126】

例示	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
化合物								
番号								
126-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CsO ₂	PhS	4-Ph-Ph	NMe

(174)

345						346		
126-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
126-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
126-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
126-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	NMe
126-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	NMe

【0218】

* * 【表127】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
					10			
127-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	NMe
127-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	NMe
127-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	NMe
127-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	NMe
127-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	NMe
127-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	Nme

【0219】

※20※ 【表128】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
128-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	NAc
128-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
128-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
128-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
128-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	NAc
128-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0220】

★ ★ 【表129】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
129-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	NAc
129-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
129-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
129-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
129-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	NAc
129-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0221】

☆ ☆ 【表130】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
-----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(175)

347

348

130-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	NAc
130-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
130-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
130-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
130-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	NAc
130-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0222】

* * 【表131】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
131-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	NAc
131-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
131-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
131-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
131-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	NAc
131-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0223】

※ ※ 【表132】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
132-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	NAc
132-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
132-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
132-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
132-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	NAc
132-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0224】

★ ★ 【表133】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
133-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	NAc
133-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
133-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
133-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
133-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	NAc
133-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0225】

☆ ☆ 【表134】

例示	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
----	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	---

(176)

349

350

化合物
番号

134-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	NAc
134-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)- Ph	NAc
134-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)- Ph	NAc
134-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)- Ph	NAc
134-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	NAc
134-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0226】

* * 【表135】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
135-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	NAc
135-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)- Ph	NAc
135-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)- Ph	NAc
135-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)- Ph	NAc
135-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	NAc
135-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0227】

※※【表136】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
136-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	NAc
136-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	NAc
136-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
136-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
136-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	NAc
136-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0228】

★ ★ 【表137】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
137-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	NAc
137-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	NAc

(177)

351						352		
137-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	NAc
137-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	NAc
137-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	NAc
137-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	NAc

【0229】

* * 【表138】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
10								
138-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhOCH ₂	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO(CH ₂) ₂	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
138-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
138-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4- ³⁰ F ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
138-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4- ⁴⁰ F ₃ -PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-Ph-5-Pyr	0
138-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
138-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4- ⁵⁰ F ₃ O-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0

(178)

353

354

138-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
138-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
138-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
138-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
138-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-71	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-72	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-73	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-74	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-75	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-76	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-77	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-78	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-79	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
138-80	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-81	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-82	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-83	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
138-84	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-85	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-86	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-87	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-88	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-89	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0

(179)

355				356			
138-90	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
138-91	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
138-92	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
138-93	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
138-94	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
138-95	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	2-Ph-5-Pyr		0
138-96	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
138-97	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
138-98	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
138-99	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-Ph-Ph		0
138-100	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
138-101	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
138-102	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
138-103	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
138-104	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
138-105	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
138-106	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
138-107	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
138-108	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
138-109	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
138-110	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
138-111	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	2-Ph-5-Pyr		0
138-112	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
138-113	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
138-114	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CN-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
138-115	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-Ph-Ph		0
138-116	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
138-117	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
138-118	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
138-119	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
138-120	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
138-121	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
138-122	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
138-123	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
138-124	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
138-125	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
138-126	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
138-127	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	2-Ph-5-Pyr		0
138-128	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
138-129	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
138-130	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeS-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
138-131	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-Ph-Ph		0
138-132	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
138-133	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
138-134	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
138-135	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
138-136	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
138-137	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
138-138	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0

(180)

357				358			
138-139	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
138-140	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
138-141	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
138-142	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
138-143	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
138-144	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
138-145	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
138-146	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
138-147	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-Ph-Ph	0	
138-148	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-HO-Ph)Ph	0	
138-149	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
138-150	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
138-151	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	
138-152	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
138-153	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
138-154	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
138-155	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
138-156	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
138-157	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
138-158	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
138-159	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
138-160	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
138-161	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
138-162	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
138-163	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-Ph-Ph	0	
138-164	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0	
138-165	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
138-166	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
138-167	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	
138-168	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
138-169	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
138-170	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
138-171	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
138-172	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
138-173	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
138-174	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
138-175	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
138-176	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
138-177	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
138-178	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,5-di-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
138-179	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4,5-tri-F-PhO	4-Ph-Ph	0	
138-180	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4,5-tri-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0	
138-181	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4,5-tri-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
138-182	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4,5-tri-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
138-183	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	3,4,5-tri-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	

(181)

359					360				
138-184	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
138-185	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
138-186	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
138-187	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
138-188	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
138-189	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
138-190	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
138-191	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
138-192	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
138-193	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
138-194	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
138-195	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-Ph-Ph	0	
138-196	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0	
138-197	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
138-198	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
138-199	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	
138-200	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
138-201	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
138-202	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
138-203	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
138-204	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
138-205	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
138-206	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
138-207	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
138-208	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	

(182)

361						362		
138-209	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-210	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-211	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-Ph-Ph	0
138-212	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-213	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-214	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-215	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-216	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-217	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-218	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-219	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-220	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-221	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-222	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-223	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	2-Ph-5-Pyr	0
138-224	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-225	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-226	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-PyrO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-227	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-Ph-Ph	0
138-228	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-229	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-230	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-231	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-232	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-233	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-234	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-235	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-236	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-237	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-238	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-239	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	2-Ph-5-Pyr	0
138-240	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
138-241	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
138-242	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzO	2-TfpO-5-Pyr	0
138-243	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-Ph-Ph	0
138-244	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
138-245	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
138-246	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(4-F-Ph)-Ph	0
138-247	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
138-248	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(Pyr-2)-Ph	0
138-249	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(Pyr-3)-Ph	0
138-250	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(Pyr-4)-Ph	0
138-251	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
138-252	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
138-253	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
138-254	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
138-255	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	2-Ph-5-Pyr	0
138-256	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-BoxaS	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0

(183)

363				364			
138-257	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	2-BoxaS	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
138-258	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	2-BoxaS	2-TfpO-5-Pyr		0
138-259	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-Ph-Ph		0
138-260	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
138-261	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
138-262	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
138-263	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
138-264	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
138-265	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
138-266	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
138-267	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
138-268	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
138-269	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
138-270	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
138-271	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	2-Ph-5-Pyr		0
138-272	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
138-273	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
138-274	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
138-275	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-276	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
138-277	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-278	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-279	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-280	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-281	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-282	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-283	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-284	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0
138-285	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-286	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
138-287	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-288	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-289	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-290	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-291	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-292	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-293	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-294	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0
138-295	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-296	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
138-297	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-298	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-299	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-300	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-301	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-302	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-303	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-304	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0
138-305	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-F-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-306	H	(CH ₂) ₂	H H CH ₂	4-F-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0

(184)

365					366				
138-307	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-308	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-309	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-310	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-311	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-312	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-313	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-314	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0
138-315	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-316	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
138-317	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-318	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-319	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-320	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-321	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-322	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-323	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-324	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0
138-325	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-Me-Ph)-Ph		0
138-326	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-Dma-Ph)-Ph		0
138-327	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0
138-328	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Me-Pyr-6)-Ph		0
138-329	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Et-Pyr-6)-Ph		0
138-330	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph		0
138-331	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0
138-332	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr		0
138-333	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0
138-334	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr		0

【0230】

* 30 * 【表 139】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
139-1	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Ph(OCH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-2	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
139-3	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-4	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-5	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-6	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-7	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-8	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-9	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
139-10	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-11	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0

(185)

367

368

139-12	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	6)-Ph	
							4-(3-Dma-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-13	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
139-14	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-	0
							5-Pyr	
139-15	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr	0
139-16	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
139-17	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-18	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-19	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-20	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
139-21	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-	0
							5-Pyr	
139-22	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
139-23	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
139-24	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-25	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-26	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-27	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
139-28	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-	0
							5-Pyr	
139-29	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-30	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
139-31	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-32	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-33	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-34	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
139-35	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-MeO-Ph)-	0
							5-Pyr	
139-36	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-37	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
139-38	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-39	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-40	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-	0
							6)-Ph	
139-41	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-	0
							Pyr	
139-42	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-	0

(186)

369

370

							5-Pyr	
139-43	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-44	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
139-45	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-46	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-47	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-48	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-49	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-50	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-51	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
139-52	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-53	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-54	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-55	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-56	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-57	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-58	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
139-59	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-60	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-61	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-62	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-63	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-64	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-65	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
139-66	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-67	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-68	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-69	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-70	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-71	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-72	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
139-73	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-74	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0

(187)

371							372	
139-75	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-76	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-77	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-78	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-79	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
139-80	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-81	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-82	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-83	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-84	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-85	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
139-86	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
139-87	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
139-88	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
139-89	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
139-90	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
139-91	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
139-92	H	(CH ₂) ₂	Cl	H	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0231】

* * 【表140】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
140-1	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-2	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-3	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
140-4	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-5	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-6	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-7	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-8	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-9	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-10	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0

(188)

373

374

140-11	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-12	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-13	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-14	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-15	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-16	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Pr	2-Tfp0-5-Pyr	0
140-17	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
140-18	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-19	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-20	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-21	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-22	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-23	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	Bu	2-Tfp0-5-Pyr	0
140-24	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
140-25	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-26	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-27	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-28	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-29	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	PhO	2-Tfp0-5-Pyr	0
140-30	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
140-31	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-32	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-33	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-34	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-35	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-36	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Tfp0-5-Pyr	0
140-37	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
140-38	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-39	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-40	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-41	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0

(189)

375							376	
140-42	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-43	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-44	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
140-45	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-46	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-47	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-48	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-49	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-50	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-51	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
140-52	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-53	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-54	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-55	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-56	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-57	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-58	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
140-59	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-60	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-61	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-62	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-63	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-64	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-65	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
140-66	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-67	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-68	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-69	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-70	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-71	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-72	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
140-73	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(190)

377							378	
140-74	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-75	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-76	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-77	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-78	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-79	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
140-80	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-81	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-82	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-83	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-84	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-85	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
140-86	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
140-87	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
140-88	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
140-89	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
140-90	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
140-91	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
140-92	H	(CH ₂) ₂	MeO	H	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0232】

* * 【表141】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
141-1	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
141-2	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-3	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-4	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-5	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-6	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-7	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-8	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0

(191)

379							380	
141-9	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-10	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-11	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-12	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-13	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-14	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr	0
141-15	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
141-16	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-17	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-18	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-19	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-20	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-21	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0
141-22	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
141-23	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-24	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-25	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-26	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-27	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-28	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-29	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
141-30	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-31	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-32	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-33	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-34	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-35	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-36	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
141-37	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-38	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-39	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-40	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0

(192)

381

382

							Pyr	
141-41	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-42	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-43	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
141-44	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-45	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-46	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-47	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-48	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-49	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-50	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
141-51	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-52	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-53	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-54	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-55	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-56	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-57	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
141-58	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-59	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-60	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-61	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-62	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-63	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-64	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
141-65	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-66	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-67	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-68	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-69	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-70	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-71	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
141-72	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(193)

383						384		
141-73	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-74	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-75	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-76	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-77	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-78	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
141-79	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-80	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-81	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-82	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-83	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-84	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
141-85	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
141-86	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
141-87	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
141-88	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
141-89	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
141-90	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
141-91	H	(CH ₂) ₂	Br	H	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0233】

* * 【表142】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
142-1	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
142-2	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-3	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-4	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-5	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-6	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-7	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-8	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0

(194)

385							386		
142-9	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0	
142-10	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
142-11	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
142-12	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
142-13	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
142-14	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Pr	2-TfpO-5-Pyr	0	
142-15	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0	
142-16	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0	
142-17	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
142-18	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
142-19	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
142-20	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
142-21	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	Bu	2-TfpO-5-Pyr	0	
142-22	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0	
142-23	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
142-24	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
142-25	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
142-26	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
142-27	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
142-28	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
142-29	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0	
142-30	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
142-31	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
142-32	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
142-33	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
142-34	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
142-35	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
142-36	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0	
142-37	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
142-38	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
142-39	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
142-40	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	

(195)

387

388

							Pyr	
142-41	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-42	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-43	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
142-44	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-45	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-46	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-47	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-48	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-49	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-50	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
142-51	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-52	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-53	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-54	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-55	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-56	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-57	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
142-58	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-59	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-60	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-61	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-62	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-63	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-64	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
142-65	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-66	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-67	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-68	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-69	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-70	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-71	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
142-72	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(196)

389						390		
142-73	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-74	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-75	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-76	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-77	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-78	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
142-79	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-80	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-81	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-82	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-83	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-84	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
142-85	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
142-86	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
142-87	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
142-88	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
142-89	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
142-90	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
142-91	H	(CH ₂) ₂	NO ₂	H	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0234】

* * 【表143】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
143-1	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
143-2	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-3	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-4	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-5	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-6	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-7	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	EtO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-8	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0

(197)

391							392		
143-9	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0	
143-10	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
143-11	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
143-12	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
143-13	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
143-14	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Pr	2-Tfp0-5-Pyr	0	
143-15	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0	
143-16	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0	
143-17	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
143-18	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
143-19	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
143-20	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
143-21	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Bu	2-Tfp0-5-Pyr	0	
143-22	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	4-Ph-Ph	0	
143-23	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	4-(Pyr-2)-Ph	0	
143-24	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
143-25	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
143-26	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
143-27	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
143-28	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	Ph0	2-Tfp0-5-Pyr	0	
143-29	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-Ph-Ph	0	
143-30	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(Pyr-2)-Ph	0	
143-31	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
143-32	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
143-33	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
143-34	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
143-35	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-iPr-Ph0	2-Tfp0-5-Pyr	0	
143-36	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-Ph0	4-Ph-Ph	0	
143-37	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-Ph0	4-(Pyr-2)-Ph	0	
143-38	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-Ph0	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
143-39	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-Ph0	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
143-40	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-Ph0	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	

(198)

393

394

							Pyr	
143-41	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-42	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-43	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-Ph-Ph	0
143-44	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-45	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-46	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-47	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-48	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-49	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Me-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-50	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
143-51	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-52	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-53	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-54	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-55	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-56	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-tBu-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-57	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-Ph-Ph	0
143-58	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-59	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-60	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-61	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-62	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-63	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ -PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-64	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-Ph-Ph	0
143-65	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-66	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-67	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-68	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-69	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-70	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-71	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	4-Ph-Ph	0
143-72	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0

(199)

395							396	
143-73	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-74	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-75	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-76	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-77	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-78	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-Ph-Ph	0
143-79	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-80	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-81	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-82	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-83	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-84	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	4-Cl-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
143-85	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	4-Ph-Ph	0
143-86	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
143-87	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
143-88	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
143-89	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
143-90	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
143-91	H	(CH ₂) ₂	Ac	H	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0

【0235】

* * 【表144】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
144-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeNH	Ph	0
144-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeNH	4-Ph-Ph	0
144-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtNH	Ph	0
144-7	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtNH	4-Ph-Ph	0
144-8	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-9	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-10	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-11	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PrNH	Ph	0
144-12	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PrNH	4-Ph-Ph	0

(200)

397

398

144-13	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PrNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-14	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PrNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-15	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PrNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-16	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BuNH	Ph	0
144-17	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BuNH	4-Ph-Ph	0
144-18	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BuNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-19	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BuNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-20	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BuNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-21	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Me ₂ N	Ph	0
144-22	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂ ¹⁰	Me ₂ N	4-Ph-Ph	0
144-23	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Me ₂ N	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-24	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Me ₂ N	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-25	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Me ₂ N	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-26	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et ₂ N	Ph	0
144-27	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et ₂ N	4-Ph-Ph	0
144-28	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et ₂ N	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-29	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et ₂ N	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-30	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Et ₂ N	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-31	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtPhN	Ph	0
144-32	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtPhN	4-Ph-Ph	0
144-33	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtPhN	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-34	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtPhN	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-35	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtPhN	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-36	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	1-Pyrr	Ph	0
144-37	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	1-Pyrr	4-Ph-Ph	0
144-38	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	1-Pyrr	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-39	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	1-Pyrr	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-40	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	1-Pyrr	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-41	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂)- PhNH	Ph	0
144-42	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂)- PhNH	4-Ph-Ph	0
144-43	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-44	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-45	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-46	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂)- PhNH	Ph	0
144-47	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂)- PhNH	4-Ph-Ph	0
144-48	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-49	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-50	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂)- PhNH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-51	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	Ph	0

(201)

399					400			
144-52	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-Ph-Ph	0
144-53	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-54	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-55	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	2-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-56	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	Ph	0
144-57	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-Ph-Ph	0
144-58	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-59	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-60	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-(PhSO ₂ NH)-Ph NH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-61	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzCO ₂ NH	Ph	0
144-62	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	²⁰ BzCO ₂ NH	4-Ph-Ph	0
144-63	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzCO ₂ NH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-64	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzCO ₂ NH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-65	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	BzCO ₂ NH	4-(Pyr-4)-Ph	0
144-66	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhNH	Ph	0
144-67	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhNH	4-Ph-Ph	0
144-68	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhNH	4-(Pyr-2)-Ph	0
144-69	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhNH	4-(Pyr-3)-Ph	0
144-70	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhNH	4-(Pyr-4)-Ph	0

【0236】

* 30 * 【表 1 4 5】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
145-1	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-Ph-Ph	0
145-2	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
145-3	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
145-4	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
145-5	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
145-6	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-7	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
145-8	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-9	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-MeO-Pyr- 6)-Ph	0
145-10	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-Dma-Pyr- 6)-Ph	0
145-11	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr- 6)-Ph	0
145-12	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	⁵⁹ 4-tBu-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr- 6)-Ph	0

(202)

401

145-13	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO
145-14	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO
145-15	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO
145-16	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO
145-17	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-18	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-19	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-20	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-21	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-22	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-23	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-24	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-25	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-26	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-27	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-28	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-29	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-30	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-31	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-32	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO
145-33	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-34	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-35	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-36	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-37	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-38	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-39	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-40	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-41	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-42	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-43	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-44	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-45	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-46	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-47	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-48	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO
145-49	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-50	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO

402

6)-Ph	
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0

(203)

403

145-51	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-52	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-53	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-54	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-55	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-56	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-57	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-58	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-59	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-60	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-61	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-62	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-63	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-64	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO
145-65	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-66	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-67	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-68	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-69	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-70	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-71	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-72	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-73	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-74	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-75	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-76	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-77	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-78	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-79	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-80	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO
145-81	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-82	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-83	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-84	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-85	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-86	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-87	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-88	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO
145-89	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO

404

4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0

(204)

405							406		
145-90	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
145-91	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
145-92	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
145-93	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
145-94	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
145-95	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
145-96	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
145-97	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-Ph-Ph	0	
145-98	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0	
145-99	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
145-100	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
145-101	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	
145-102	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
145-103	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
145-104	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
145-105	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
145-106	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
145-107	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
145-108	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
145-109	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
145-110	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	
145-111	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0	
145-112	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CN-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0	
145-113	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-Ph-Ph	0	
145-114	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0	
145-115	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0	
145-116	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0	
145-117	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0	
145-118	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0	
145-119	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0	
145-120	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0	
145-121	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0	
145-122	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0	
145-123	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0	
145-124	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0	
145-125	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	2-Ph-5-Pyr	0	
145-126	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0	

(205)

407							408		
145-127	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	2-(4-MeO-Ph)-	5-Pyr	0
145-128	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeS-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
145-129	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-Ph-Ph		0
145-130	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
145-131	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
145-132	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
145-133	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
145-134	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
145-135	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
145-136	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
145-137	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
145-138	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
145-139	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
145-140	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
145-141	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-Ph-5-Pyr		0
145-142	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
145-143	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
145-144	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-MeSO ₂ -PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
145-145	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-Ph-Ph		0
145-146	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
145-147	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
145-148	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
145-149	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0
145-150	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph		0
145-151	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph		0
145-152	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph		0
145-153	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph		0
145-154	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph		0
145-155	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph		0
145-156	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph		0
145-157	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-Ph-5-Pyr		0
145-158	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0
145-159	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr		0
145-160	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,4-di-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr		0
145-161	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-Ph-Ph		0
145-162	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph		0
145-163	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph		0
145-164	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph		0
145-165	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3,5-di-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph		0

(206)

409

410

145-166	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-167	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
145-168	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-169	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
145-170	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
145-171	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
145-172	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
145-173	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
145-174	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
145-175	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
145-176	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 5-di-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
145-177	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-Ph-Ph	0
145-178	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
145-179	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
145-180	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
145-181	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
145-182	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-183	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
145-184	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-185	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
145-186	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
145-187	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
145-188	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
145-189	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
145-190	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
145-191	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
145-192	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3, 4, 5-tri-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
145-193	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-Ph-Ph	0
145-194	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
145-195	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
145-196	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
145-197	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
145-198	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-199	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6-penta-F-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0

(207)

411

412

						penta-F-PhO		
145-200	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-201	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	4-(3-MeO-Pyr- 6)-Ph	0
145-202	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	4-(3-Dma-Pyr- 6)-Ph	0
145-203	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	4-(3-CF ₃ -Pyr- 6)-Ph	0
145-204	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	4-(3-O ₂ N-Pyr- 6)-Ph	0
145-205	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
145-206	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
145-207	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	2-(4-MeO-Ph)- 5-Pyr	0
145-208	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2, 3, 4, 5, 6- penta-F-PhO	2-TfpO-5-Pyr	0
145-209	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-Ph-Ph	0
145-210	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
145-211	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
145-212	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
145-213	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
145-214	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-215	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-3)-Ph	0
145-216	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-217	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(3-MeO-Pyr- 6)-Ph	0
145-218	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(3-Dma-Pyr- 6)-Ph	0
145-219	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(3-CF ₃ -Pyr- 6)-Ph	0
145-220	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	4-(3-O ₂ N-Pyr- 6)-Ph	0
145-221	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	2-Ph-5-Pyr	0
145-222	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
145-223	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	2-(4-MeO-Ph)- 5-Pyr	0
145-224	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	3-PyrO	2-TfpO-5-Pyr	0
145-225	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-Ph-Ph	0
145-226	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(4-HO-Ph)-Ph	0
145-227	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
145-228	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(4-F-Ph)-Ph	0
145-229	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
145-230	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(Pyr-2)-Ph	0
145-231	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(Pyr-3)-Ph	0
145-232	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(Pyr-4)-Ph	0
145-233	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO	4-(3-MeO-Pyr- 6)-Ph	0

(208)

413

145-234	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-235	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-236	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-237	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-238	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-239	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-240	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	BzO
145-241	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-242	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-243	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-244	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-245	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-246	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-247	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-248	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-249	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-250	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-251	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-252	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-253	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-254	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-255	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-256	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	2-BoxaS
145-257	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-258	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-259	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-260	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-261	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-262	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-263	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-264	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-265	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-266	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-267	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-268	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO
145-269	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO

414

6)-Ph	
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0
2-(4-F-Ph)-5-Pyr	0
2-(4-MeO-Ph)-5-Pyr	0
2-TfpO-5-Pyr	0
4-Ph-Ph	0
4-(4-HO-Ph)-Ph	0
4-(4-MeO-Ph)-Ph	0
4-(4-F-Ph)-Ph	0
4-(4-Cl-Ph)-Ph	0
4-(Pyr-2)-Ph	0
4-(Pyr-3)-Ph	0
4-(Pyr-4)-Ph	0
4-(3-MeO-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-Dma-Pyr-6)-Ph	0
4-(3-CF ₃ -Pyr-6)-Ph	0
4-(3-O ₂ N-Pyr-6)-Ph	0
2-Ph-5-Pyr	0

(209)

415								416							
145-270	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO		2-(4-F-Ph)-5-Pyr		0					
145-271	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO		2-(4-MeO-Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-272	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-(Pyr-2)-PhO		2-TfpO-5-Pyr		0					
145-273	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(4-Me-Ph)-Ph		0					
145-274	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(4-Dma-Ph)-Ph		0					
145-275	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0					
145-276	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(3-Me-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-277	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(3-Et-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-278	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		4-(3-EtO-Pyr-		0					
								6)-Ph							
145-279	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0					
145-280	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		2-(4-CF ₃ -Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-281	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0					
145-282	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-tBu-PhO		2-(4-Dma-Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-283	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	20-CF ₃ -PhO		4-(4-Me-Ph)-Ph		0					
145-284	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		4-(4-Dma-Ph)-Ph		0					
145-285	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0					
145-286	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		4-(3-Me-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-287	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		4-(3-Et-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-288	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		4-(3-EtO-Pyr-		0					
								6)-Ph							
145-289	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0					
145-290	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	39-CF ₃ -PhO		2-(4-CF ₃ -Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-291	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0					
145-292	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ -PhO		2-(4-Dma-Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-293	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		4-(4-Me-Ph)-Ph		0					
145-294	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		4-(4-Dma-Ph)-Ph		0					
145-295	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph		0					
145-296	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		4-(3-Me-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-297	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	40-CF ₃ O-PhO		4-(3-Et-Pyr-6		0					
)-Ph							
145-298	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		4-(3-EtO-Pyr-		0					
								6)-Ph							
145-299	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		2-(4-Me-Ph)-5-Pyr		0					
145-300	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		2-(4-CF ₃ -Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-301	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr		0					
145-302	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-CF ₃ O-PhO		2-(4-Dma-Ph)-		0					
								5-Pyr							
145-303	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(4-Me-Ph)-Ph		0					

(210)

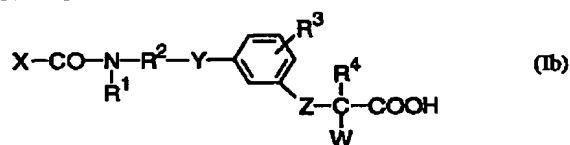
417								418	
145-304	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
145-305	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
145-306	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
145-307	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
145-308	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
145-309	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
145-310	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
145-311	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
145-312	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-F-PhO		2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0
145-313	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(4-Me-Ph)-Ph	0
145-314	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(4-Dma-Ph)-Ph	0
145-315	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	0
145-316	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(3-Me-Pyr-6)-Ph	0
145-317	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(3-Et-Pyr-6)-Ph	0
145-318	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		4-(3-EtO-Pyr-6)-Ph	0
145-319	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		2-(4-Me-Ph)-5-Pyr	0
145-320	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		2-(4-CF ₃ -Ph)-5-Pyr	0
145-322	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		2-(4-Cl-Ph)-5-Pyr	0
145-323	H	(CH ₂) ₂	H	Me	CH ₂	4-Cl-PhO		2-(4-Dma-Ph)-5-Pyr	0

【0238】

【0237】

【表146】

【化4】



例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
146-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-Ph-Ph	0
146-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-2)-Ph	0
146-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-3)-Ph	0
146-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	4-(Pyr-4)-Ph	0
146-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	2-Ph-5-Pyr	0
146-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	EtO	3-Ph-6-Pyr	0

(211)

419

420

【0239】

* * 【表147】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
147-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-Ph-Ph	0
147-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-2)-Ph	0
147-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-3)-Ph	0
147-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	4-(Pyr-4)-Ph	0
147-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	2-Ph-5-Pyr	0
147-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pr	3-Ph-6-Pyr	0

【0240】

※ ※ 【表148】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
148-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-Ph-Ph	0
148-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-2)-Ph	0
148-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-3)-Ph	0
148-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	4-(Pyr-4)-Ph	0
148-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	2-Ph-5-Pyr	0
148-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Bu	3-Ph-6-Pyr	0

【0241】

★ ★ 【表149】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
149-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-Ph-Ph	0
149-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-2)-Ph	0
149-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-3)-Ph	0
149-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	4-(Pyr-4)-Ph	0
149-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	2-Ph-5-Pyr	0
149-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Pen	3-Ph-6-Pyr	0

【0242】

☆ ☆ 【表150】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
150-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-Ph-Ph	0
150-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-2)-Ph	0
150-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-3)-Ph	0
150-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	4-(Pyr-4)-Ph	0
150-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	2-Ph-5-Pyr	0

(212)

421								422	
150-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	MeS	3-Ph-6-Pyr	0	

【0243】

* * 【表151】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
151-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-Ph-Ph	0
151-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
151-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
151-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
151-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	2-Ph-5-Pyr	0
151-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0244】

※ ※ 【表152】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
152-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-Ph-Ph	0
152-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
152-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
152-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
152-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
152-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-iPr-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0245】

★ ★ 【表153】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
153-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-Ph-Ph	0
153-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-2)-Ph	0
153-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-3)-Ph	0
153-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	4-(Pyr-4)-Ph	0
153-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	2-Ph-5-Pyr	0
153-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	4-MeO-PhO	3-Ph-6-Pyr	0

【0246】

☆ ☆ 【表154】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
154-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-Ph-Ph	0
154-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-2)-Ph	0
154-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-3)-Ph	0

(213)

423						424		
154-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	4-(Pyr-4)-Ph	0
154-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	2-Ph-5-Pyr	0
154-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	PhS	3-Ph-6-Pyr	0

【0247】

* * 【表155】

例示 化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Z	W	X	Y
155-1	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-Ph-Ph	0
155-2	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-2)-Ph	0
155-3	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-3)-Ph	0
155-4	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	4-(Pyr-4)-Ph	0
155-5	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	2-Ph-5-Pyr	0
155-6	H	(CH ₂) ₂	H	H	CH ₂	Ph(CH ₂) ₃	3-Ph-6-Pyr	0

上記表において、

(1) 好適には例示化合物番号

1-15、1-16、1-17、1-19、1-21、
 1-35、1-37、1-39、1-90、1-92、
 1-93、1-94、1-95、1-96、1-97、
 1-98、1-99、1-100、1-101、1-1
 02、1-103、1-104、1-105、1-10
 6、1-107、1-108、1-109、1-11
 0、1-111、1-112、1-143、1-15
 0、1-179、1-189、1-190、1-19
 1、1-204、1-205、1-206、1-20
 7、1-208、1-209、1-210、1-21
 1、1-212、1-213、1-214、1-21
 5、1-216、1-217、1-218、1-21
 9、1-220、1-221、1-222、1-22
 3、1-224、1-225、1-226、1-22
 7、1-228、1-229、1-230、1-23
 1、1-232、1-233、1-234、1-23
 5、1-236、1-242、1-243、1-24
 4、1-246、3-15、3-16、3-17、3-
 19、3-21、3-35、3-37、3-39、3-
 90、3-92、3-93、3-94、3-95、3-
 96、3-97、3-98、3-99、3-100、3
 -101、3-102、3-103、3-104、3-
 105、3-106、3-107、3-108、3-1
 09、3-110、3-111、3-112、3-14
 3、3-150、3-179、3-189、3-19
 0、3-191、3-204、3-205、3-20
 6、3-207、3-208、3-209、3-21
 0、3-211、3-212、3-213、3-21
 4、3-215、3-216、3-217、3-21
 8、3-219、3-220、3-221、3-22
 2、3-223、3-224、3-225、3-22

6、3-227、3-228、3-229、3-23
 0、3-231、3-232、3-233、3-23
 4、3-235、3-236、3-242、3-24
 3、3-244、3-246、4-15、4-16、4
 -17、4-19、4-21、4-35、4-37、4
 -39、4-90、4-92、4-93、4-94、4
 -95、4-96、4-97、4-98、4-99、4
 -100、4-101、4-102、4-103、4-
 104、4-105、4-106、4-107、4-1
 08、4-109、4-110、4-111、4-11
 2、4-143、4-150、4-179、4-18
 9、4-190、4-191、4-193、4-20
 4、4-205、4-206、4-207、4-20
 8、4-209、4-210、4-211、4-21
 2、4-213、4-214、4-215、4-21
 6、4-217、4-218、4-219、4-22
 0、4-221、4-222、4-223、4-22
 4、4-225、4-226、4-227、4-22
 8、4-229、4-230、4-231、4-23
 2、4-233、4-234、4-235、4-23
 6、4-242、4-243、4-244、4-24
 6、5-15、5-16、5-17、5-19、5-2
 1、5-35、5-37、5-39、5-90、5-9
 2、5-93、5-94、5-95、5-96、5-9
 7、5-98、5-99、5-100、5-101、5
 -102、5-103、5-104、5-105、5-
 106、5-107、5-108、5-109、5-1
 10、5-111、5-112、6-15、6-16、
 6-17、6-19、6-21、6-35、6-37、
 6-39、6-90、6-92、6-93、6-94、
 6-95、6-96、6-97、6-98、6-99、
 6-100、6-101、6-102、6-103、6
 -104、6-105、6-106、6-107、6-

(214)

425

108、6-109、6-110、6-111、6-1
 12、6-143、6-150、6-179、6-18
 9、6-190、6-191、6-204、6-20
 5、6-206、6-207、6-208、6-20
 9、6-210、6-211、6-212、6-21
 3、6-214、6-215、6-216、6-21
 7、6-218、6-219、6-220、6-22
 1、6-222、6-223、6-224、6-22
 5、6-226、6-227、6-228、6-22
 9、6-230、6-231、6-232、6-23
 3、6-234、6-235、6-236、6-24
 2、6-243、6-244、6-246、7-15、
 7-16、7-17、7-19、7-21、7-35、
 7-37、7-39、7-90、7-92、7-93、
 7-94、7-95、7-96、7-97、7-98、
 7-99、7-100、7-101、7-102、7-
 103、7-104、7-105、7-106、7-1
 07、7-108、7-109、7-110、7-11
 1、7-112、7-143、7-150、7-17
 9、7-189、7-190、7-191、7-20
 4、7-205、7-206、7-207、7-20
 8、7-209、7-210、7-211、7-21
 2、7-213、7-214、7-215、7-21
 6、7-217、7-218、7-219、7-22
 0、7-221、7-222、7-223、7-22
 4、7-225、7-226、7-227、7-22
 8、7-229、7-230、7-231、7-23
 2、7-233、7-234、7-235、7-23
 6、7-242、7-243、7-244、7-24
 6、8-15、8-16、8-17、8-19、8-2
 1、8-35、8-37、8-39、8-90、8-9
 2、8-93、8-94、8-95、8-96、8-9
 7、8-98、8-99、8-100、8-101、8
 -102、8-103、8-104、8-105、8-
 106、8-107、8-108、8-109、8-11
 0、8-111、8-112、8-143、8-15
 0、8-179、8-189、8-190、8-19
 1、8-204、8-205、8-206、8-20
 7、8-208、8-209、8-210、8-21
 1、8-212、8-213、8-214、8-21
 5、8-216、8-217、8-218、8-21
 9、8-220、8-221、8-222、8-22
 3、8-224、8-225、8-226、8-22
 7、8-228、8-229、8-230、8-231、
 8-232、8-233、8-234、8-235、8
 -236、8-242、8-243、8-244、8-
 246、9-15、9-16、9-17、9-19、9
 -21、9-35、9-37、9-39、9-90、9
 -92、9-93、9-94、9-95、9-96、9
 -97、9-98、9-99、9-100、9-10

426

1、9-102、9-103、9-104、9-10
 5、9-106、9-107、9-108、9-10
 9、9-110、9-111、9-112、10-1
 1、10-15、10-16、10-17、10-1
 9、10-21、10-35、10-37、10-3
 9、10-90、10-92、10-93、10-9
 4、10-95、10-96、10-97、10-9
 8、10-99、10-100、10-101、10-
 102、10-103、10-104、10-105、
 10-106、10-107、10-108、10-1
 09、10-110、10-111、10-112、1
 1-5、11-11、11-12、11-13、11-
 37、12-5、12-11、12-12、12-1
 3、12-37、13-5、13-11、13-12、
 13-13、13-37、14-5、14-11、14
 -12、14-13、14-37、14-42、14-
 43、14-44、14-45、14-46、14-4
 7、14-48、14-49、14-50、14-5
 1、14-52、14-53、14-54、14-5
 5、14-61、14-62、14-64、14-6
 5、14-66、14-67、14-68、14-6
 9、14-70、14-73、14-74、14-7
 5、14-76、14-77、14-78、14-8
 4、14-85、14-86、14-88、15-5、
 15-11、15-12、15-13、15-37、1
 5-42、15-43、15-44、15-45、15
 -46、15-47、15-48、15-49、15-
 50、15-51、15-52、15-53、15-5
 4、15-55、15-61、15-62、15-6
 4、15-65、15-66、15-67、15-6
 8、15-69、15-70、15-73、15-7
 4、15-75、15-76、15-77、15-7
 8、15-84、15-85、15-86、15-8
 8、16-5、16-11、16-12、16-13、
 16-37、17-5、17-11、17-12、17
 -13、17-37、18-2、18-3、18-4、
 18-5、18-16、19-2、19-3、19-
 4、19-5、19-16、20-2、20-3、20
 -4、20-5、20-16、20-30、20-3
 3、20-37、20-39、20-42、20-5
 2、20-53、20-70、20-71、20-7
 9、20-80、23-2、23-3、23-4、23
 -5、23-16、24-2、24-3、24-4、2
 4-5、24-16、25-2、25-3、25-4、
 25-5、25-16、28-2、28-3、28-
 4、28-5、28-16、28-17、28-18、
 28-19、28-20、28-21、28-22、2
 8-23、28-24、28-25、28-31、28
 -32、28-33、28-34、28-35、28-
 36、28-37、28-38、28-39、28-4

(215)

427

0、28-41、28-42、28-43、29-2、
 29-3、29-4、29-5、29-16、29-1
 7、29-18、29-19、29-20、29-2
 1、29-22、29-23、29-24、29-2
 5、29-31、29-32、29-33、29-3
 4、29-35、29-36、29-37、29-3
 8、29-39、29-40、29-41、29-4
 2、29-43、30-2、30-3、30-4、30
 -5、30-16、30-17、30-18、30-1
 9、30-20、30-21、30-22、30-2
 3、30-24、30-25、30-31、30-3
 2、30-33、30-34、30-35、30-3
 6、30-37、30-38、30-39、30-4
 0、30-41、30-42、30-43、31-2、
 31-3、31-4、31-5、31-16、31-1
 7、32-2、32-3、32-4、32-5、32-
 16、32-17、33-2、33-3、33-4、3
 3-5、33-16、33-17、33-18、33-
 19、33-20、33-21、33-22、33-2
 3、33-24、33-25、33-31、33-3
 2、33-33、33-34、33-35、33-3
 6、33-37、33-38、33-39、33-4
 0、33-41、33-42、33-43、33-4
 9、33-50、33-51、33-53、34-2、
 34-3、34-4、34-5、34-16、34-1
 7、34-18、34-19、34-20、34-2
 1、34-22、34-23、34-24、34-2
 5、34-31、34-32、34-33、34-3
 4、34-35、34-36、34-37、34-3
 8、34-39、34-40、34-41、34-4
 2、34-43、34-49、34-50、34-5
 1、34-53、35-2、35-3、35-4、35
 -5、35-16、35-17、35-18、35-1
 9、35-20、35-21、35-22、35-2
 3、35-24、35-25、35-31、35-3
 2、35-33、35-34、35-35、35-3
 6、35-37、35-38、35-39、35-4
 0、35-41、35-42、35-43、35-4
 9、35-50、35-51、35-53、36-2、
 36-3、36-4、36-5、36-16、36-1
 7、37-2、37-3、37-4、37-5、37-
 16、37-17、38-2、38-3、38-4、3
 8-5、38-31、38-34、38-38、38-
 40、38-43、39-2、39-3、39-4、3
 9-5、39-31、39-34、39-38、39-
 40、39-43、40-2、40-3、40-4、4
 0-5、40-31、40-34、40-38、40-
 40、40-43、43-2、43-3、43-4、4
 3-5、43-31、43-34、43-38、43-
 40、43-43、44-2、44-3、44-4、4

428

4-5、44-31、44-34、44-38、44-
 40、44-43、45-2、45-3、45-4、4
 5-5、45-31、45-34、45-38、45-
 40、45-43、58-2、58-3、58-4、5
 8-5、58-16、58-17、59-2、59-
 3、59-4、59-5、59-16、59-17、6
 0-2、60-3、60-4、60-5、60-16、
 60-17、63-2、63-3、63-4、63-
 5、63-16、63-17、64-2、64-3、6
 4-4、64-5、64-16、64-17、65-
 2、65-3、65-4、65-5、65-16、65
 -17、77-2、77-3、77-4、77-5、7
 8-2、78-3、78-4、78-5、78-16、
 78-17、79-2、79-3、79-4、79-
 5、79-16、79-17、80-2、80-3、8
 0-4、80-5、80-16、80-17、83-
 2、83-3、83-4、83-5、83-16、83
 -17、84-2、84-3、84-4、84-5、8
 4-16、84-17、85-2、85-3、85-
 4、85-5、85-16、85-17、88-1、8
 8-2、88-3、88-4、88-5、88-6、8
 9-1、89-2、89-3、89-4、89-5、8
 9-6、90-1、90-2、90-3、90-4、9
 0-5、90-6、93-1、93-2、93-3、9
 3-4、93-5、93-6、94-1、94-2、9
 4-3、94-4、94-5、94-6、95-1、9
 5-2、95-3、95-4、95-5、95-6、9
 8-1、98-2、98-3、98-4、98-5、9
 8-6、103-1、103-2、103-3、103
 -4、103-5、103-6、104-1、104-
 2、104-3、104-4、104-5、104-
 6、105-1、105-2、105-3、105-
 4、105-5、105-6、138-2、138-
 3、138-4、138-5、138-6、138-
 7、138-8、138-9、138-10、138-
 11、138-12、138-13、138-14、1
 38-15、138-16、138-17、138-1
 8、138-19、138-20、138-21、13
 8-22、138-23、138-24、138-2
 5、138-26、138-27、138-28、13
 8-29、138-30、138-31、138-3
 2、138-33、138-34、138-35、13
 8-36、138-37、138-38、138-3
 9、138-40、138-41、138-42、13
 8-43、138-44、138-45、138-4
 6、138-47、138-48、138-49、13
 8-50、138-51、138-52、138-5
 3、138-54、138-55、138-56、13
 8-57、138-58、138-59、138-6
 0、138-61、138-62、138-63、13

(216)

429

8-64、138-65、138-66、138-6
 7、138-68、138-69、138-70、13
 8-71、138-72、138-73、138-7
 4、138-75、138-76、138-77、13
 8-78、138-79、138-80、138-8
 1、138-82、138-83、138-84、13
 8-85、138-86、138-87、138-8
 8、138-89、138-90、138-91、13
 8-92、138-93、138-94、138-9
 5、138-96、138-97、138-98、13 10
 8-99、138-104、138-105、138-
 106、138-107、138-108、138-1
 11、138-112、138-113、138-11
 4、138-115、138-120、138-12
 1、138-122、138-123、138-12
 4、138-127、138-128、138-12
 9、138-130、138-131、138-13
 6、138-137、138-138、138-13
 9、138-140、138-143、138-14
 4、138-145、138-146、138-14 20
 7、138-152、138-153、138-15
 4、138-155、138-156、138-15
 9、138-160、138-161、138-16
 2、138-163、138-168、138-16
 9、138-170、138-171、138-17
 2、138-175、138-176、138-17
 7、138-178、138-179、138-18
 4、138-185、138-186、138-18
 7、138-188、138-191、138-19
 2、138-193、138-194、138-19 30
 5、138-200、138-201、138-20
 2、138-203、138-204、138-20
 7、138-208、138-209、138-21
 0、138-211、138-216、138-21
 7、138-218、138-219、138-22
 0、138-223、138-224、138-22
 5、138-226、138-227、138-23
 2、138-233、138-234、138-23
 5、138-236、138-239、138-24
 0、138-241、138-242、138-24 40
 3、138-248、138-249、138-25
 0、138-251、138-252、138-25
 5、138-256、138-257、138-25
 8、138-259、138-264、138-26
 5、138-266、138-267、138-26
 8、138-271、138-272、138-27
 3、138-274、138-275、138-28
 5、138-295、138-305、138-31
 5、138-325、139-24、139-31、1
 40-2、140-31、141-23、141-3 50

430

0、142-23、142-30、143-23、14
 3-30、144-8、144-13、144-18、
 144-28、144-33、144-63、145-
 1、145-6、145-7、145-8、145-
 9、145-10、145-13、145-14、14
 5-15、145-16、145-17、145-2
 2、145-23、145-24、145-25、14
 5-26、145-29、145-30、145-3
 1、145-32、145-33、145-38、14
 5-39、145-40、145-41、145-4
 2、145-45、145-46、145-47、14
 5-48、145-49、145-54、145-5
 5、145-56、145-57、145-58、14
 5-61、145-62、145-63、145-6
 4、145-65、145-70、145-71、14
 5-72、145-73、145-74、145-7
 7、145-78、145-79、145-80、14
 5-81、145-86、145-87、145-8
 8、145-89、145-90、145-93、14 20
 5-94、145-95、145-96、145-9
 7、145-102、145-111、145-11
 2、145-118、145-127、145-12
 8、145-134、145-143、145-14
 4、145-150、145-159、145-16
 0、145-166、145-175、145-17
 6、145-182、145-191、145-19
 2、145-198、145-207、145-20
 8、145-214、145-223、145-22
 4、145-230、145-239、145-24
 0、145-246、145-255、145-25 30
 6、145-262、145-271、145-27
 2、145-273、145-283、145-29
 3、145-303、145-313、の化合物。

(2) 更に好適には例示化合物番号

1-15、1-35、1-37、1-39、1-95、
 1-110、1-179、1-189、1-190、1
 -191、1-204、1-205、1-206、1-
 207、1-208、1-209、1-210、1-2
 12、1-213、1-219、1-222、1-22
 3、1-224、1-225、1-226、1-22 40
 7、1-228、1-229、1-230、1-23
 1、1-232、1-233、1-234、1-23
 5、1-236、1-242、1-243、1-24
 4、3-15、3-35、3-37、3-39、3-9
 5、3-110、3-179、3-189、3-19
 0、3-191、3-204、3-205、3-20
 6、3-207、3-208、3-209、3-21
 0、3-212、3-213、3-219、3-22
 2、3-223、3-224、3-225、3-22
 6、3-227、3-228、3-229、3-23 50

(217)

431

0、3-231、3-232、3-233、3-23
 4、3-235、3-236、3-242、3-24
 3、3-244、4-15、4-35、4-37、4-
 39、4-95、4-96、4-98、4-106、4-
 -110、4-143、4-150、4-179、4-
 189、4-190、4-191、4-193、4-2
 04、4-205、4-206、4-207、4-20
 8、4-209、4-210、4-211、4-21
 2、4-213、4-214、4-215、4-21
 6、4-217、4-218、4-219、4-22
 0、4-221、4-222、4-223、4-22
 4、4-225、4-226、4-227、4-22
 8、4-229、4-230、4-231、4-23
 2、4-233、4-234、4-235、4-23
 6、4-242、4-243、4-244、5-15、
 5-35、5-37、5-39、5-95、5-11
 0、6-15、6-35、6-37、6-39、6-9
 5、6-96、6-110、6-179、6-189、
 6-190、6-191、6-204、6-205、6-
 -206、6-207、6-208、6-209、6-
 210、6-212、6-213、6-219、6-2
 22、6-223、6-224、6-225、6-22
 6、6-227、6-228、6-229、6-23
 0、6-231、6-232、6-233、6-23
 4、6-235、6-236、6-242、6-24
 3、6-244、7-15、7-35、7-37、7-
 39、7-95、7-110、7-179、7-18
 9、7-190、7-191、7-204、7-20
 5、7-206、7-207、7-208、7-20
 9、7-210、7-212、7-213、7-21
 9、7-222、7-223、7-224、7-22
 5、7-226、7-227、7-228、7-22
 9、7-230、7-231、7-232、7-23
 3、7-234、7-235、7-236、7-24
 2、7-243、7-244、8-15、8-35、8-
 -37、8-39、8-95、8-110、8-17
 9、8-189、8-190、8-191、8-20
 4、8-205、8-206、8-207、8-20
 8、8-209、8-210、8-212、8-21
 3、8-219、8-222、8-223、8-22
 4、8-225、8-226、8-227、8-22
 8、8-229、8-230、8-231、8-23
 2、8-233、8-234、8-235、8-23
 6、8-242、8-243、8-244、9-15、
 9-35、9-37、9-39、9-95、9-11
 0、14-5、14-11、14-12、14-13、
 14-37、14-44、14-45、14-47、1
 4-64、14-67、14-73、14-75、14
 -78、14-84、14-85、14-86、15-
 5、15-11、15-12、15-13、15-3

432

7、15-44、15-45、15-47、15-6
 4、15-67、15-73、15-75、15-7
 8、15-84、15-85、15-86、17-1
 1、20-53、20-71、20-80、28-2、
 28-3、28-4、28-5、28-16、28-1
 7、28-19、28-22、28-31、28-3
 4、28-38、28-40、28-43、30-3、
 33-2、33-3、33-4、33-5、33-1
 6、33-1733-19、33-22、33-31、
 33-34、33-38、33-40、33-43、3
 3-49、33-50、33-51、34-2、34-
 3、34-4、34-5、34-16、34-1734
 -19、34-22、34-31、34-34、34-
 38、34-40、34-43、35-49、35-5
 0、35-51、35-2、35-3、35-4、35
 -5、35-16、35-1735-19、35-2
 2、35-31、35-34、35-38、35-4
 0、35-43、35-49、35-50、35-5
 1、37-3、38-2、38-3、38-4、38-
 5、39-2、39-3、39-4、39-5、40-
 2、40-3、40-4、40-5、43-2、43-
 3、43-4、43-5、44-2、44-3、44-
 4、44-5、45-2、45-3、45-4、45-
 5、77-3、138-2、138-3、138-8、
 138-9、138-10、138-11、138-1
 2、138-15、138-16、138-17、13
 8-18、138-19、138-24、138-2
 5、138-26、138-27、138-28、13
 8-31、138-32、138-33、138-3
 4、138-35、138-40、138-41、13
 8-42、138-43、138-44、138-4
 7、138-48、138-49、138-50、13
 8-51、138-56、138-57、138-5
 8、138-59、138-60、138-63、13
 8-64、138-65、138-66、138-6
 7、138-72、138-73、138-74、13
 8-75、138-76、138-79、138-8
 0、138-81、138-82、138-83、13
 8-88、138-89、138-90、138-9
 1、138-92、138-95、138-96、13
 8-97、138-98、138-104、138-1
 20、138-136、138-152、138-16
 8、138-184、138-200、138-21
 6、138-232、138-248、138-26
 4、138-275、138-285、138-29
 5、138-305、138-315、138-32
 5、139-24、139-31、140-2、140
 -31、141-23、141-30、142-23、
 142-30、143-23、143-30、144-
 13、144-63、145-6、145-15、14

(218)

433

5-16、145-22、145-31、145-32、145-47、145-48、145-54、145-63、145-64、145-70、145-79、145-80、145-86、145-95、145-96、145-102、145-118、145-134、145-150、145-166、145-182、145-198、145-214、145-230、145-246、145-262、145-273、145-283、145-293、145-303、145-313、の化合物。

【0248】更に好適には

- 1) 2-エトキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 2) 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-プロピルプロピオン酸
- 3) 2-ブチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 4) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-ブチルプロピオン酸
- 5) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 6) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメチルアミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 7) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 8) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 9) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 10) 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 11) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシ-3,5-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 12) 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 13) 2-ブチル-3-[4-[2-(4-ジエチルアミノベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
- 14) 2-ブチル-3-[4-[3-[4-(2-ピリ

434

- ジル)ベンゾイルアミノ]プロポキシ]フェニル]プロピオン酸
- 15) 2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 16) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸
 - 17) 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸
 - 18) 3-[4-[2-(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸
 - 19) 3-[4-[2-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸
 - 20) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 21) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸
 - 22) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 23) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 24) 3-[4-[2-[2-(4-フルオロフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸
 - 25) 3-[4-[2-[2-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸
 - 26) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 27) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ニトロピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 28) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-メトキシピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸
 - 29) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イ

(219)

435

ル) ベンゾイルアミノ]エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 30) 2- (4-メトキシフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 31) 2- (3-フェニルプロピル) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 32) 2- (4-メチルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 33) 2- (4-tert-ブチルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 34) 2- (4-フルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 35) 2- (4-クロロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 36) 2- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 37) 2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 38) 2- (3-フルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 39) 2- (3, 5-ジフルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 40) 2- (3, 4-ジフルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 41) 2- (3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 42) 2- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 43) 2-メチル-2-フェノキシ-3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 44) 2- (4-イソプロピルフェノキシ) -2-メチル-3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
 45) 2- (4-イソプロピルフェノキシ) -3- [4- [2- [2- (4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル] -2-メチ

436

ルプロピオン酸

46) 3- [4- [2- [2- (2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル] -2- (4-イソプロピルフェノキシ) -2-メチルプロピオン酸

からなる群から選択されるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルである。

【0249】特に好適には

- 1) 2-エトキシ-3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 2) 3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] -2-プロピルプロピオン酸
- 3) 2-ブチル-3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 4) 2-ブチル-3- [4- [2- (4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 5) 2-ブチル-3- [4- [2- (4'-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 6) 2-フェノキシ-3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 7) 3- [4- [2- (ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-フェノキシプロピオン酸
- 8) 3- [4- [2- (4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-フェノキシプロピオン酸
- 9) 3- [4- [2- (4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-フェノキシプロピオン酸
- 10) 2- (4-イソプロピルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 11) 3- [4- [2- (ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2- (4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸
- 12) 2- (4-イソプロピルフェノキシ) -3- [4- [2- (2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 13) 2- (4-イソプロピルフェノキシ) -3- [4- [2- [2- (4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸
- 14) 3- [4- [2- [2- (4-フルオロフェニ

(220)

437

ル) ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ] フェニル] -2-(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

15) 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ] フェニル] -2-(4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸

16) 2-(4-イソプロピルフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(3-メトキシピリジン-6-イル) ベンゾイルアミノ]エトキシ] フェニル] プロピオン酸

17) 2-(4-イソプロピルフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(3-ジメチルアミノピリジン-6-イル) ベンゾイルアミノ]エトキシ] フェニル] プロピオン酸

18) 2-(4-メトキシフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

19) 2-(4-メチルフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

20) 2-(4-t-ブチルフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

21) 2-(4-フルオロフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

22) 2-(4-クロロフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

23) 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

24) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -

438

3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

25) 2-(3-フルオロフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

26) 2-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ) -3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

27) 2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

28) 2-(4-イソプロピルフェノキシ) -2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸

29) 2-(4-イソプロピルフェノキシ) -3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル) ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ] フェニル] -2-メチルプロピオン酸

30) 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ) ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ] フェニル] -2-(4-イソプロピルフェノキシ) -2-メチルプロピオン酸

からなる群から選択されるアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルである。

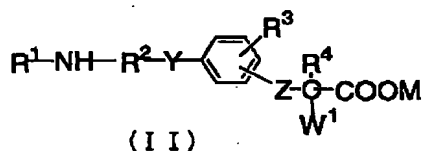
【0250】

【発明の実施の形態】本発明の前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルは、以下のA法に従って容易に製造される。

【0251】《A法》

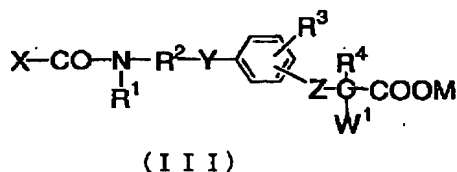
【0252】

【化5】



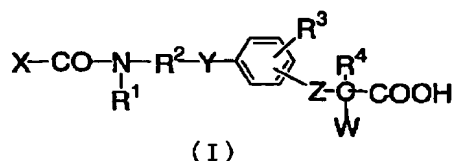
第A1工程

アシル化



第A2工程

脱エステル化



(221)

439

上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 W 、 X 、 Y および Z は、前述したものと同意義を示し、 W^1 は W が1級もしくは2級アミノ基を示す場合に該アミノ基が α -ブトキシカルボニルのような通常の保護基で保護されたアミノ基を示し、 W^1 がその他の基を示す場合は W^1 は W と同意義を示し、 M は前述した前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸がエステルを形成する場合に該エステル残基を示す。

【0253】第A1工程

第A1工程は、前記一般式(III)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(II)を有する化合物をアシル化することによって製造される。

【0254】本反応は、有機合成化学において一般に広く知られているアミド結合を形成させる反応であり、通常、溶剤の存在下で好適に行われる。

【0255】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えば不活性溶剤、好適には、ジクロロメタン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類、酢酸エチルのようなエステル類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、 N 、 N -ジメチルホルムアミドのようなアミド類があげられる。

【0256】反応は、縮合剤で処理することにより行われる。

【0257】使用される縮合剤としては、 N 、 N -ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩のようなカルボジイミド類；ジフェニルホスホリルアジド、ジエチルホスホリルシアナイドのようなホスホリル化合物；カルボニルジイミダゾール、トリフェニルホスフィン-アゾジカルボン酸ジエチル；等があげられるが、好適には、カルボニルジイミダゾール、カルボジイミド類である。ホスホリル化合物を使用する場合には、トリエチルアミン、 N -メチルモルホリン等の三級アミンの存在下で行なうのが好ましい。

【0258】また、本反応は、本反応に使用するカルボン酸またはその塩をクロルギ酸エチル、クロルギ酸イソブチル等のクロルギ酸低級アルキルエステル類と、トリエチルアミン、 N -メチルモルホリン等の三級アミンの存在下で反応させ、混合酸無水物を形成させるか、本反応に使用するカルボン酸またはその塩を N -ヒドロキシスクシンイミド、 N -ヒドロキシベンズトリアゾール、 p -ニトロフェノール等と、 N 、 N -ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類の存在下で反応させ、相当する活性エステルを形成させた後に、これらをアミンと縮合させることにより達成される。

【0259】反応は通常、溶剤の存在下で好適に行われる。使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えば不活性溶剤、好適には、ジクロロメタン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水

440

素類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、ベンゼン、トルエンのような芳香属炭化水素類をあげることができる。

【0260】更にまた、本反応に使用するカルボン酸またはその塩をハロゲン化剤、好適には、五塩化リン、オキザリルクロライド、チオニルクロライド等、と反応させ、相当するアシルハライドを得、これをアミンと上記で述べたと同様に反応させることによって得られる。

反応は通常、溶剤の存在下で好適に行われる。使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えば不活性溶剤、好適には、ジクロロメタンのようなハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類、ベンゼン、トルエンのような芳香属炭化水素類をあげられる。

【0261】反応温度は -20°C ないし 100°C で行われ、好適には -5°C ないし 50°C で行われる。

【0262】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常30分間ないし24時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0263】第A2工程

第A2工程は、前記一般式(I)を有するアミドカルボン酸誘導体を製造する工程であり、前記一般式(III)を有する化合物のエステル残基を除去することによって行われる。

【0264】本工程は、溶剤の存在下で、塩基で加水分解することで達成される。

【0265】本反応において、使用される溶剤は反応に影響を与えない溶剤であれば特に限定はなく、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、メトキシエタノールのようなアルコール類；水；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられる。

【0266】反応に使用される塩基としては、例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩などがあげられる。好適にはアルカリ金属水酸化物である。

【0267】反応温度は、使用される溶剤、塩基により異なるが、 0°C ないし 140°C であり、好適には 10°C ないし 120°C である。

【0268】反応時間は、使用される溶剤、塩基、反応温度などにより異なるが、通常10分間ないし24時間であり、好適には30分間ないし16時間である。

【0269】また本工程は、エステル残基が α -ブチル基、ジフェニルメチル基または p -メトキシベンジル基の場合には溶剤の存在下または非存在下で、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、 p -トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸、塩酸、硫酸のような鉱酸と反応させることによって行われる。好適にはトリフ

(222)

441

ルオロ酢酸または塩酸である。

【0270】本反応において、溶剤を使用する場合、反応に影響を与えない溶剤であれば特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；水；またはこれらの混合溶剤が用いられる。好適にはエーテル類である。

【0271】反応温度は、使用される酸により異なるが、-10℃ないし120℃であり、好適には0℃ないし100℃である。

【0272】反応時間は、使用される酸、反応温度などにより異なるが、通常10分間ないし24時間であり、好適には30分間ないし16時間である。

【0273】更に、本工程はエステル残基がベンジル基、ジフェニルメチル基のようなアラルキル基の場合、前記一般式(III)を有する化合物に接触水素添加反応を行うことによっても行われる。使用される触媒は、例えばパラジウム-炭素、パラジウム黒、酸化白金、白金黒などがあげられ、好適にはパラジウム-炭素である。

【0274】反応は通常、溶剤の存在下で好適に行われ

442

る。使用される溶剤としては、反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ギ酸、酢酸のようなカルボン酸類；またはこれらの混合溶剤が用いられる。好適にはアルコール類である。

【0275】反応温度は10℃ないし140℃であり、好適には20℃ないし120℃である。

【0276】反応時間は、反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常30分間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0277】なお、W¹が α -ブトキシカルボニルのような通常の保護基で保護された1級もしくは2級アミノ基を示す場合は、上記反応終了後、公知の方法、例えば塩酸のような酸と室温で30分間ないし2時間反応させて脱保護することができる。

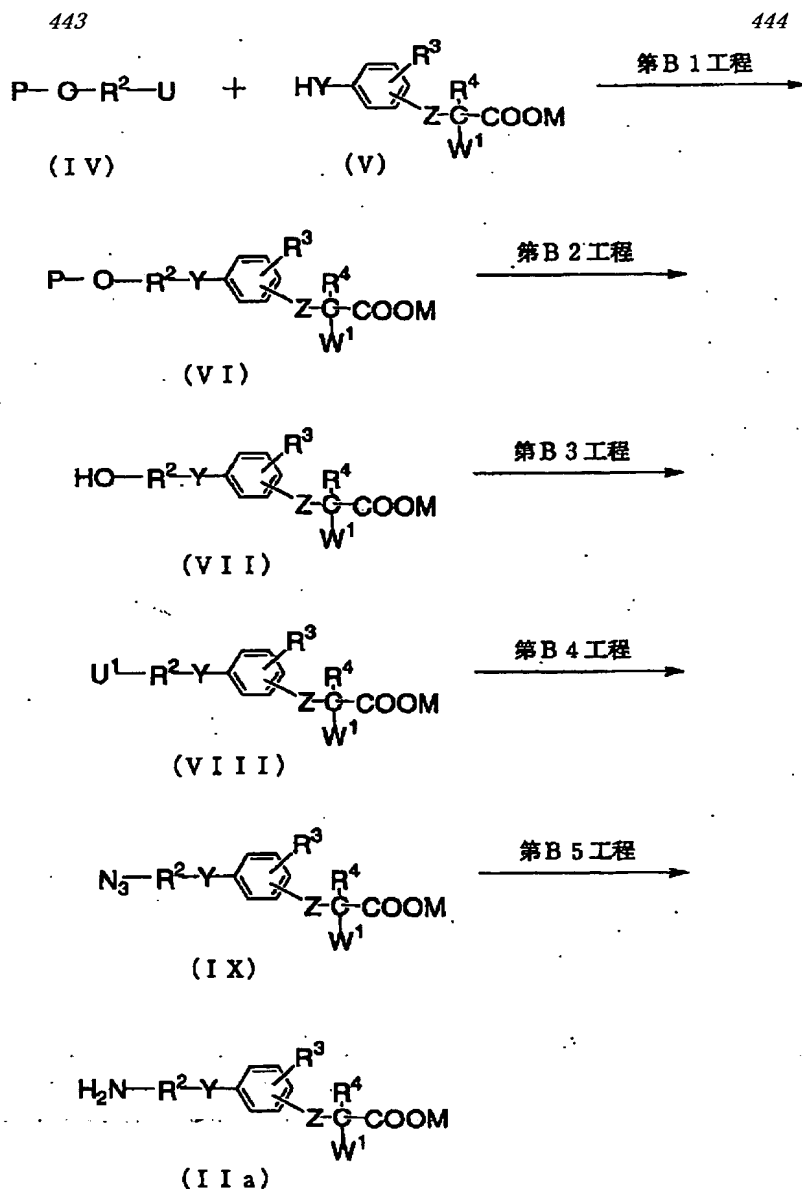
【0278】A法における前記一般式(II)において、R¹が水素原子を有する化合物(IIa)は、B法またはC法に従って製造することもできる。

【0279】《B法》

【0280】

【化6】

(223)



上記式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y 、 Z 、 W^1 および M は、前述したものと同意義を示す。

【0281】 P は、2-テトラヒドロピラニル基、メトキシメチル基等のような通常の水酸基の保護基を示し、 U は水酸基、ハロゲン原子（好適には塩素原子、臭素原子、碲素原子）または式 $-\text{O}-\text{SO}_2-\text{R}^6$ を有する基（式中、 R^6 はメチルもしくはエチルのような炭素数1ないし6個を有するアルキル基；トリフルオロメチルのような炭素数1ないし4個を有するハロゲン化アルキル基；またはフェニル、 p -トリル、 p -ニトロフェニルもしくは p -ブロモフェニルのような置換分として炭素数1ないし4個を有するアルキル、ニトロもしくはハロゲンを有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基）を示す。 U^1 は、 U におけるハロゲン原子または式 $-\text{O}-\text{SO}_2-\text{R}^6$ を有する基（式中、 R^6 は前述したものと同意義を示す。）を示す。

【0282】第B1工程

B法における第B1工程は、前記一般式(VI)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(IV)を有する化合物と前記一般式(V)を有する化合物とを反応させることによって製造される。

【0283】 U が水酸基である場合は、通常的光延反応[0. Mitsunobu, シンセシス (Synthesis), 1頁 (1981年)] に準じた反応に付することによって行われる。

【0284】反応は通常、溶剤の存在下でアゾ化合物類とホスフィン類とを接触させることによって行われる。反応試薬のアゾ化合物類としては、アゾジカルボン酸ジエチルのようなアゾジカルボン酸C1-C4アルキル、1、1'-（アゾジカルボニル）ジピペリジンのようなアゾジカルボキサミドなどが用いられる。ホスフィン類としては、トリフェニルホスフィンのようなトリアリールホスフィン、トリブチルホスフィンのようなトリ(C1-C4アルキル)ホスフィンなどが用いられる。

50 【0285】反応は通常、溶剤の存在下で好適に行われ

(224)

445

る。使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、1、2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられ、好適には炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類またはエーテル類である。反応温度は10℃ないし100℃

【0286】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常1時間ないし3日間であり、好適には5時間ないし2日間である。

【0287】Uがハロゲン原子または式 $-O-SO_2-R^6$ を有する基（式中、 R^6 は前述したものと同意義を示す。）である場合には、不活性溶剤中、塩基の存在下で、反応させることにより行われる。

【0288】使用される塩基は、好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド、リチウムメトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；ブチリチウム、メチルリチウムのようなアルキルリチウム類；リチウムジエチルアミド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス（トリメチルシリル）アミドのようなリチウムアミド類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素化物；または1、5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン、1、8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン、N、N-ジイソプロピルエチルアミンのような三級有機アミンであり、更に好適にはアルカリ金属炭酸塩、アルカリ金属水素化物またはアルカリ金属アルコキシドである。

【0289】反応に使用される不活性溶剤は、反応に関与しなければ特に限定はなく、例えば、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類；テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、t-ブタノールのようなアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノンのようなアミド類；アセトン、2-ブタノンのようなケトン類；アセトニトリルのようなニトリル類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；またはこれらの混合溶剤であり得、好適にはエーテル類、アミド類、ケトン類またはスルホキシド類である。

【0290】本反応をベンジルトリエチルアンモニウムヨードライド、テトラブチルアンモニウムヨードライドのよ

446

うな相移動触媒の存在下で行う場合には、塩基として水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物を用い、水と塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類の二層系の溶剤中で行われる。

【0291】反応温度は、-10℃ないし120℃であり、好適には10℃ないし100℃である。反応時間は、使用される試薬、反応温度などにより異なるが、30分間ないし48時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0292】第B2工程

第B2工程は、前記一般式(VII)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(VI)を有する化合物の2-テトラヒドロピラニル基のような水酸基の保護基を除去することによって行われる。

【0293】本反応は、すでにA法の第A2工程において説明した酸による脱保護の方法と同様に行われる。

【0294】第B3工程

第B3工程は、前記一般式(VIII)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(VII)を有する化合物の水酸基をハロゲン原子または式 $-O-SO_2-R^6$ を有する基（式中、 R^6 は前述したものと同意義を示す。）に変換することによって行われる。

【0295】ハロゲン化反応は、塩酸、臭化水素酸等のハロゲン化水素酸、塩化チオニル、臭化チオニル、三塩化リン、三臭化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン等の無機酸のハロゲン化物、N、N-ジメチルクロロホルミニウム、N、N-ジメチルプロモホルミニウム等の Vilsmeyer試薬、トリフェニルホスフィンと四塩化炭素又は四臭化炭素、またはトリエチルホスフィンジクロライド、トリエチルホスフィンジブromaid等のリン化合物を含めたハロゲン化試薬を、溶剤を用いることなく、あるいは不活性溶剤中、反応させることにより行われる。

【0296】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、1、2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられるが、好適には炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類またはエーテル類である。

【0297】反応温度は-50℃ないし150℃であり、好適には0℃ないし80℃である。

【0298】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常30分間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0299】スルホネート化反応は、 $R^6-SO_2-U^2$

(225)

447

または $(R^6-SO_2)_2O$ の一般式を示す試薬 (式中、 R^6 は前述したものと同意義、 U^2 はハロゲン原子 (好適には塩素原子) を示す。) を、不活性溶媒中、塩基の存在下で、反応させることにより行われる。

【0300】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、1、2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ピリジン、コリジンのような窒素含有芳香属化合物類；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられが、好適にはハロゲン化炭化水素類または窒素含有芳香属化合物類である。

【0301】使用される塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素化物；またはトリエチルアミン、N-メチルモルホリン、N、N-ジイソプロピルエチルアミン、1、5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン、1、8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカー 7-エンのような三級有機アミンであり、好適には三級有機アミンである。

【0302】反応温度は-70℃ないし100℃であり、好適には0℃ないし80℃である。

【0303】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常3.0時間ないし48時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0304】第B4工程
第B4工程は、前記一般式 (IX) を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式 (VII) を有する化合物のハロゲン原子または式 $-O-SO_2-R^6$ を有する基 (式中、 R^6 は前述したものと同意義を示す。) をアジド基に変換することによって行われる。

【0305】本反応は、アジ化ナトリウムのような金属アジ化物またはテトラブチルアンモニウムアジドのような有機アジ化物を、不活性溶剤中、反応させることにより行われる。

【0306】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエ

448

ン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、1、2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられが、好適にはエーテル類またはアミド類である。

10 【0307】反応温度は0℃ないし150℃であり、好適には20℃ないし100℃である。

【0308】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常1時間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0309】第B5工程

第B5工程は、前記一般式 (IIa) を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式 (IX) を有する化合物のアジド基をアミノ基に変換することによって行われる。

20 【0310】本反応は、不活性溶剤中、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、Lindlar 触媒等を触媒とした接触還元、トリフェニルホスフィン等による還元反応を行うことによって達成される。

【0311】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が用いられが、好適にはアルコール類またはエーテル類である。

【0312】反応温度は0℃ないし150℃であり、好適には20℃ないし100℃である。

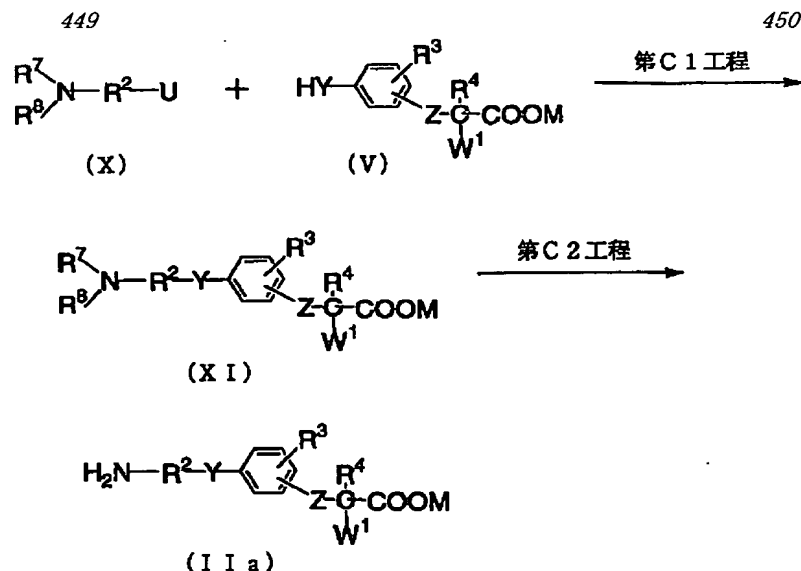
【0313】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常1時間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

《C法》

40 【0314】

【化7】

(226)



上記式中、R²、R³、R⁴、U、X、Y、W¹ およびMは、前述したものと同意義を示す。

【0315】R⁷は水素原子を示し、R⁸はアミノ基の保護基を示すか、R⁷ およびR⁸ がアミノ基の保護基を示すか、またはR⁷ とR⁸ は一緒になってアミノ基の保護基を示す。

【0316】R⁷ またはR⁸ のアミノ基の保護基は、有機合成化学でよく知られている保護基であり、例えばベンジル、ジフェニルメチル、トリチルのようなC7-C14アラルキル基；ホルミル、トリフルオロアセチルのようなフッ素で置換されていてもよいC1-C4脂肪族アシル基；t-ブトキシカルボニルのようなC1-C4アルコキシカルボニル基；ベンジルオキシカルボニル、p-メトキシベンジルオキシカルボニルもしくはp-ニトロベンジルオキシカルボニルのようなメトキシまたはニトロで置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基；等があげられ、R⁷とR⁸ が一緒になってアミノ基の保護基を示す場合、例えばフタロイル基等があげられ、好適にはt-ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルまたはフタロイルである。

【0317】第C1工程

第C1工程は前記一般式(XI)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(X)を有する化合物と前記一般式(V)を有する化合物とを反応させることにより行われる。

【0318】本工程はB法の第B1工程と同様に行われる。

【0319】第C2工程

第C2工程は、前記一般式(IIa)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(XI)を有する化合物中のアミノ基の保護基を除去することにより行われる。

【0320】保護基R⁷またはR⁸ がアラルキル基、アラルキルオキシカルボニル基のように接触還元により除

去できる基、またはトリチル基、t-ブトキシカルボニル基のように酸により除去できる基の脱保護反応は、A法の第A2工程と同様の方法で行われる。

【0321】保護基R⁷またはR⁸ がホルミル、トリフルオロアセチルのような脂肪族アシル基の場合は、塩基性の条件下で除去される。

【0322】使用される塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩があげられる。好適にはアルカリ金属水酸化物である。

【0323】本反応は、不活性溶剤、例えばメタノール、エタノールのようなアルコール類；水；テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；またはこれらの混合溶剤中で好適に行われる。更に好適にはアルコール類である。

【0324】反応温度は、0℃ないし100℃であり、好適には10℃ないし80℃である。

【0325】反応時間は、反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常30分間ないし24時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0326】R⁷ とR⁸ が一緒になってアミノ基の保護基がフタロイル基の場合は、ヒドラジン類または一級アミン類と処理することにより、保護基を除去することができる。

【0327】使用されるヒドラジン類としては、例えばヒドラジン、メチルヒドラジン、フェニルヒドラジン等があげられ、好適にはヒドラジンである。また使用される一級アミン類としては、例えばメチルアミン、エチルアミン、プロピルアミン、ブチルアミン、イソブチルアミン、ペンチルアミンまたはヘキシルアミン等があげられ、好適にはプロピルアミンまたはブチルアミンである。

【0328】本反応は、不活性溶剤、例えばメタノー

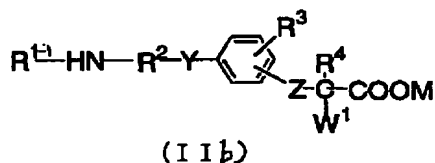
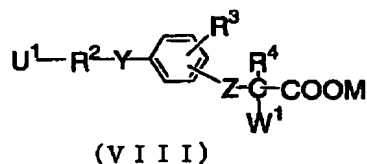
(227)

451

ル、エタノールのようなアルコール類；テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；またはこれらの混合溶剤が好適に用いられる。好適にはアルコール類である。

【0329】反応温度は、0℃ないし100℃であり、好適には10℃ないし80℃である。

【0330】反応時間は、反応試薬、反応温度、溶剤な*



上記式中、R²、R³、R⁴、U¹、Y、Z、W¹ およびMは、前述したものと同意義を示す。R¹⁻¹は、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし12個を有するアラルキル基を示す。

【0334】第D1工程

第D1工程は、前記一般式(I I b)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(V I I I)で表わされる化合物と前記一般式(X I I)で表されるアミンを反応させることによって行われる。

【0335】本反応は、不活性溶剤中、塩基の存在下または非存在下にて行われる。

【0336】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリア※

452

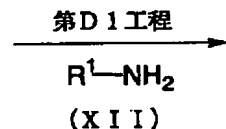
* どのによって異なるが、通常30分間ないし24時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0331】A法における前記一般式(I I)において、R¹がアルキル基またはアラルキル基である化合物は、D法またはE法に従って製造することもできる。

【0332】《D法》

【0333】

【化8】



※ミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が用いられ、好適にはエーテル類またはアミド類である。

【0337】使用される塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素化物；またはトリエチルアミン、N-メチルモルホリン、N、N-ジイソプロピルエチルアミン、1、5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン、1、8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン、のような三級有機アミンであり、好適にはアルカリ金属炭酸塩または三級有機アミンである。

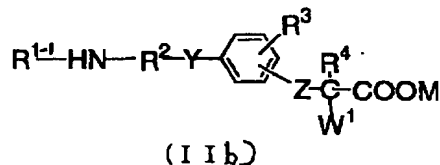
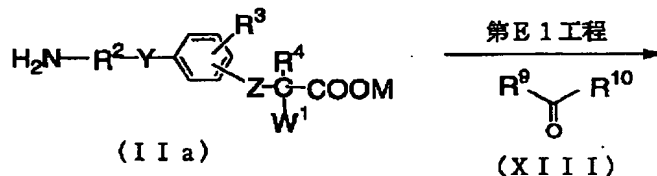
【0338】反応温度は0℃ないし150℃であり、好適には20℃ないし100℃である。

【0339】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常1時間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0340】《E法》

【0341】

【化9】



上記式中、R¹⁻¹、R²、R³、R⁴、Y、Z、W¹およびMは、前述したものと同意義を示す。

(228)

453

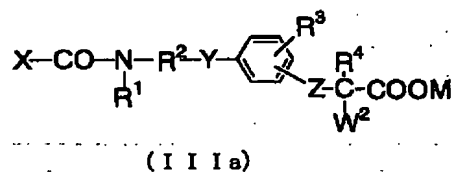
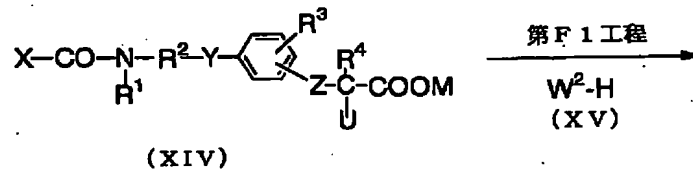
【0342】 R^9 は、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基または炭素数7ないし12個を有するアラルキル基、 R^{10} は、炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし12個を有するアラルキル基または水素原子を示す。

【0343】第E1工程

第E1工程は、前記一般式(IIb)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(IIa)で表わされる化合物と前記一般式(XII)で表わされるカルボニル化合物とを反応させることによって行われる。

【0344】本反応は、水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウム等の金属水素化物による還元条件下、またはパラジウム-炭素、ラネーニッケル等を触媒とした接触還元条件下、不活性溶剤中にて行われる。

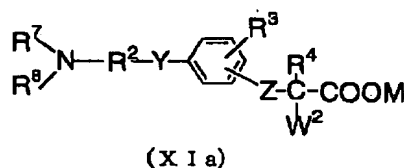
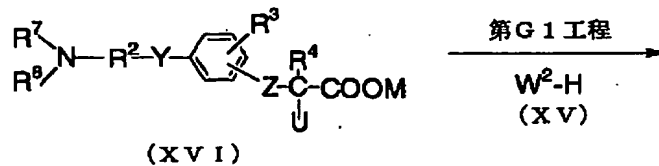
【0345】使用される溶剤としては、本反応に影響を与えなければ特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンのような炭化水素 *



上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 U 、 X 、 Y 、 Z および M は、前述したものと同意義を示す。 W^2 は前述した W におけるアリールオキシ基、複素芳香環基、アリールチオ基または複素芳香環チオ基を示す。

【0351】第F1工程

F法における第F1工程は、前記一般式(II Ia)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(XIV)を有する化合物と前記一般式(XV)を有する化合物とを反応させることによって製造される。



454

*類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類； N 、 N -ジメチルホルムアミド、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が用いられ、好適にはアルコール類またはアミド類である。

【0346】反応温度は 0°C ないし 150°C であり、好適には 20°C ないし 100°C である。

【0347】反応時間は反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常1時間ないし3日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0348】A法における前記一般式(II I)において、 W がアリールオキシ基、複素芳香環オキシ基、アリールチオ基または複素芳香環チオ基である化合物(II I a)は、F法に従って製造することもできる。

【0349】《F法》

【0350】

【化10】

【0352】本工程はB法の第B1工程と同様に行われる。

【0353】C法における前記一般式(XI)において、 W がアリールオキシ基、複素芳香環オキシ基、アリールチオ基または複素芳香環チオ基である化合物(XI a)は、G法に従って製造することもできる。

【0354】《G法》

【0355】

【化11】

(229)

455

上記式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^7 、 R^8 、 U 、 W^2 、 Y 、 Z および M は、前述したものと同意義を示す。

【0356】第G1工程

G法における第G1工程は、前記一般式(XI a)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(XV I)を有する化合物と前記一般式(XV)を有する化合物とを反応させることによって製造される。

【0357】本工程はB法の第B1工程と同様に行われ*

*る。

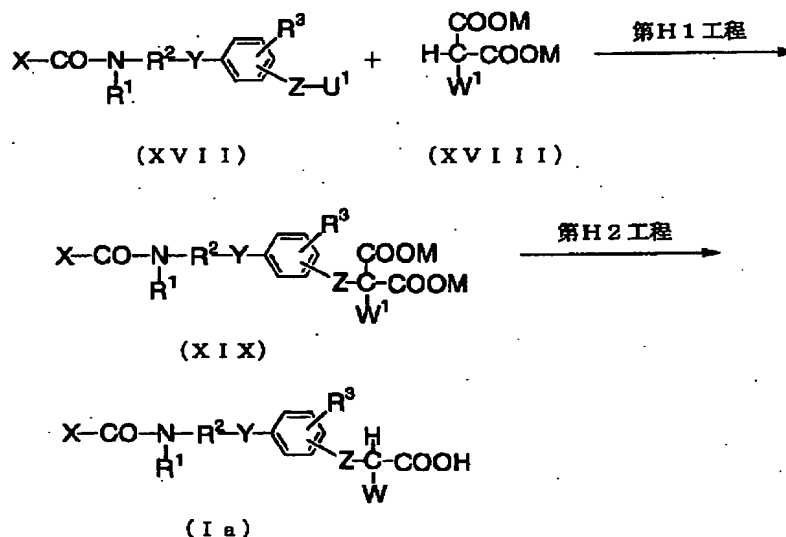
【0358】A法における前記一般式(I)において、 R^4 が水素原子である化合物(I a)は、H法に従って製造することもできる。

【0359】《H法》

【0360】

【化12】

456



上記式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 U^1 、 W 、 W^1 、 Y 、 Z および M は、前述したものと同意義を示す。

【0361】第H1工程

H法における第H1工程は、前記一般式(XIX)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(XV I)を有する化合物と前記一般式(XV I I I)を有する化合物とを反応させることによって製造される。

【0362】本反応は、不活性溶剤中、塩基の存在下で反応させることにより行われる。

【0363】使用される塩基は、好適には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウムのようなアルカリ金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド、リチウムメトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；ブチルリチウム、メチルリチウムのようなアルキルリチウム類；リチウムジエチルアミド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミドのようなリチウムアミド類；または1、5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン、1、8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカー-7-エンのような三級有機アミンであり、更に好適にはアルカリ金属水素化物、アルカリ金属アルコキシドまたはリチウムアミド類である。

【0364】反応に使用される不活性溶剤は、反応に参与しなければ特に限定はなく、例えば、ベンゼン、トルエンのような炭化水素類；テトラヒドロフラン、ジオキ

サンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、 t -ブタノールのようなアルコール類； N 、 N -ジメチルホルムアミド、 N 、 N -ジメチルアセトアミド、 N -メチルピロリジノンのようなアミド類；アセトン、2-ブタノンのようなケトン類；アセトニトリルのようなニトリル類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；またはこれらの混合溶剤であり得、好適にはエーテル類、アミド類、ケトン類またはスルホキシド類である。

【0365】本反応をベンジルトリエチルアンモニウムヨウダイド、テトラブチルアンモニウムヨウダイドのような相移動触媒の存在下で行う場合には、塩基として水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水素化物を用い、水と塩化メチレン、クロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類の二層系の溶剤中で行われる。

【0366】反応温度は、 -10°C ないし 120°C であり、好適には 10°C ないし 100°C である。反応時間は、使用される試薬、反応温度などにより異なるが、30分間ないし48時間であり、好適には1時間ないし16時間である。

【0367】第H2工程

第H2工程は、前記一般式(I a)を有するフェニルアルキルカルボン酸誘導体を製造する工程であり、前記一般式(XIX)を有する化合物マロン酸ジエステル誘導

(230)

457

体のエステル残基を除去後脱炭酸化することによって行われる。

【0368】本工程におけるエステル残基の除去は、前述したA法第A2工程と同様に行うことにより達成される。

【0369】脱炭酸の工程は、一般式(XIX)のエステル残基の除去によって製造されるマロン酸誘導体を、溶剤の存在下で、加熱することにより達成される。

【0370】本工程において、使用される溶剤は反応に影響を与えない溶剤であれば特に限定はなく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ヘプタンのような炭化水素類；クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；エタノール、プロパノール、メトキシエタノール、エチレングリコールのようなアルコール類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトア

458

*ミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；またはこれらの混合溶剤が用いられる。好適には炭化水素類またはアルコール類である。

【0371】反応温度は60℃ないし180℃であり、好適には80℃ないし150℃である。

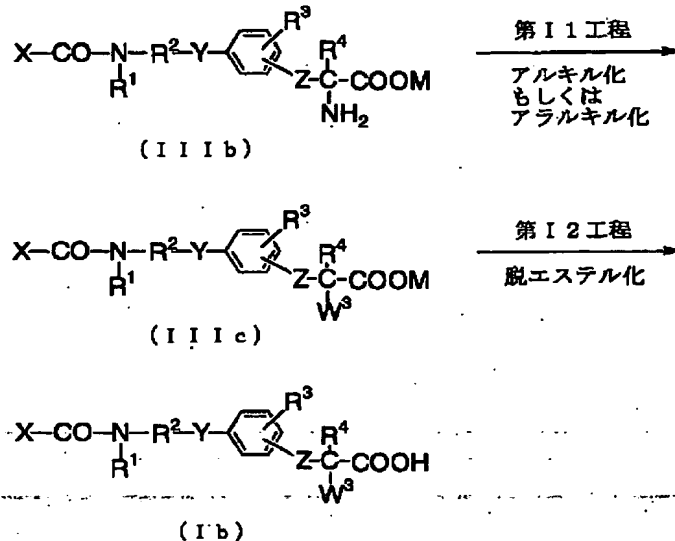
【0372】反応時間は、反応試薬、反応温度、溶剤などによって異なるが、通常30分間ないし2日間であり、好適には1時間ないし24時間である。

【0373】A法における前記一般式(I)において、Wがアルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基もしくはアラキルアミノ基である化合物(Ib)は、I法に従って製造することもできる。

【0374】《I法》

【0375】

【化13】



上記式中、R¹、R²、R³、R⁴、X、Y、ZおよびMは、前述したものと同意義を示す。W³は、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のモノアルキルアミノ基、同一もしくは異なって各アルキルが炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のジアルキルアミノ基もしくは炭素数7ないし12個を有するアラキルアミノ基を示す。

【0376】第I1工程

第I1工程は、前記一般式(I I I c)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(I I I b)で表わされる化合物をアルキル化もしくはアラキル化することによって行われる。

【0377】本反応は、アルキル化剤としてハロゲン化アルキル、ハロゲン化アラキル、アルキルスルホネートもしくはアラキルスルホネートを用いる場合、B法の第B1工程と同様に行われる。

【0378】カルボニル化合物を用い還元的にアルキル

化を行う場合は、E法の第E1工程と同様に行われる。

【0379】第I2工程

第I2工程は、前記一般式(I b)を有する化合物を製造する工程であり、前記一般式(I I I c)で表わされる化合物のエステル残基を除去することによって行われる。

【0380】本工程は、A法の第A2工程と同様に行われる。

【0381】前記の各工程によって得られた目的化合物は、反応終了後、必要に応じて常法、例えばカラムクロマトグラフィー、再結晶法、再沈殿法などによって精製することができる。例えば、適宜反応液を中和し、次いで反応液に溶剤を加えて抽出し、抽出液より溶剤を留去する。得られた残渣をシリカゲル等を用いたカラムクロマトグラフィーに付すことによって精製し、目的化合物の純品を得ることができる。

【0382】本発明の前記一般式(I)を有するアミド

(231)

459

カルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルは、優れた血糖降下作用、脂質低下作用、インスリン抵抗性改善作用、抗炎症作用、免疫調節作用、アルドース還元酵素阻害作用、5-リボキシゲナーゼ阻害作用、過酸化脂質生成抑制作用、PPAR活性化作用、抗骨粗鬆症作用および神経細胞死阻害作用等を有し、例えば糖尿病、高脂血症、肥満症、耐糖能不全、インスリン抵抗性非耐糖能不全、高血圧症、脂肪肝、糖尿病合併症（例えば網膜症、腎症、神経症、白内障、冠動脈疾患等）、動脈硬化症、妊娠糖尿病、多嚢胞卵巣症候群、アテローム性動脈硬化症または虚血性心疾患により惹起される細胞損傷（例えば脳卒中により惹起される脳損傷等）のような、主にインスリン抵抗性に起因する疾病；骨関節炎、疼痛、発熱、リウマチ性関節炎、炎症性腸炎、アクネ、日焼け、乾癬、湿疹、アレルギー性疾患、喘息、GI潰瘍、癌、悪液質、自己免疫疾患、肺炎のような炎症性疾患；骨粗鬆症；白内障；脳卒中、炎症性脳疾患、神経変性疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病のような神経系疾患；筋ジストロフィー；等の予防剤および／または治療剤（特に治療剤）として有用である。

【0383】本発明の前記一般式（I）を有するアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはそのエステルは、種々の形態で投与される。その投与形態としては特に限定はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じて決定される。例えば錠剤、丸剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤およびカプセル剤の場合には経口投与される。また注射剤の場合には単独であるいはぶどう糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内投与される。坐剤の場合には直腸内投与される。好適には経口投与である。これらの各種製剤は、常法に従って主薬に賦形剤、結合剤、崩壊剤、潤沢剤、溶解剤、矯味矯臭、コーティング剤等既知の医薬製剤分野において通常使用しうる既知の補助剤を用いて製剤化することができる。

【0384】錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用でき、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ぶどう糖、尿素、澱粉、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ぶどう糖液、澱粉液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン糖の結合剤、乾燥澱粉、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、澱粉、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加

460

油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、澱粉等の保湿剤、澱粉、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、硼酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が例示できる。更に錠剤は必要に応じ通常の剤皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

10 【0385】丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用でき、例えばぶどう糖、乳糖、澱粉、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナランカンテン等の崩壊剤等が例示できる。坐剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用でき、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセリド等を挙げることができる。

20 【0386】注射剤として調製される場合には、液剤および懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これら液剤、乳剤および懸濁剤の形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものを全て使用でき、例えば水、エチルアルコール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等を挙げることができる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するに十分な量の食塩、ぶどう糖、あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。

30 【0387】更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有せしめてもよい。

【0388】上記医薬製剤中に含まれる有効成分化合物の量は、特に限定されず広範囲に適宜選択されるが、通常全組成物中1～70重量%、好ましくは1～30重量%含まれる量とするのが適当である。

40 【0389】その投与量は、症状、年齢、体重、投与方法および剤型等によって異なるが、通常は成人に対して1日、下限として0.001mg（好ましくは0.01mg、更に好ましくは0.1mg）であり、上限として2.000mg（好ましくは200mg、更に好ましくは20mg）を1回ないし数回投与することができる。

【0390】

【実施例】次に実施例、参考例、試験例および製剤例をあげて本発明を更に詳細に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

50 実施例1 2-エトキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]

(232)

461

プロピオン酸エチル (例示化合物番号 1-35 のエチルエステル)

参考例 1 で得られた 2-エトキシ-3-[4-(2-フタロイルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 760 mg をメタノール 5 ml に溶解し、80%ヒドラジン-水和物 0.125 ml を加え、室温で 1.5 時間放置した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加えた。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮すると、アミノ体が得られた。

【0391】一方 4-(2-ピリジル)安息香酸 400 mg を無水ジクロロメタン 10 ml に懸濁し、この懸濁液にカルボニルジイミダゾール 400 mg を加え、室温で 1.5 時間攪拌し、均一の溶液とした。この溶液に、上記のアミノ体を塩化メチレン 5 ml に溶解した溶液を加え、室温で 30 分間攪拌した。この反応溶液中に 4-(2-ピリジル)安息香酸 200 mg とカルボニルジイミダゾール 170 mg を追加し、一晩放置した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加えた。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ジクロロメタン:メタノール=20:1)に付して精製すると、ガム状の目的化合物 135 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0392】1.08-1.29 (6H, m), 2.95- (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.35 (1H, quintuplet, $J=7.0$ Hz), 3.60 (1H, quintuplet, $J=7.0$ Hz), 3.83-4.30 (7H, m), 6.72 (1H, t, $J=4.5$ Hz), 6.86 (1H, t, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.25-7.40 (1H, m), 7.72-8.01 (4H, m), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.70-8.80 (1H, m)。

実施例 2 2-エトキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号 1-35)

実施例 1 で得られた 2-エトキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 135 mg およびメタノール 2 ml の溶液に 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 0.55 ml を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物よりメタノールを減圧下で留去した後、1 N 塩酸 0.55 ml および酢酸エチルを加えた。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮するとガム状の目的化合物 121 mg が得られた。

【0393】得られた目的化合物をメタノール 3 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 0.28 ml

462

を加え、濃縮すると、無定形固形の目的化合物のナトリウム塩 128 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0394】1.00 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.66 (2H, dd, $J=9.0, 14.0$ Hz), 2.88 (2H, dd, $J=3.5, 14.0$ Hz), 3.42-3.70 (5H, m), 4.05-4.13 (1H, m), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.14 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.32-7.41 (1H, m), 7.85-8.09 (4H, m), 8.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.69 (1H, d, $J=4.0$ Hz), 8.80 (1H, t, $J=5.5$ Hz)。

実施例 3 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 9-35 のエチルエステル)

参考例 2 で得られた 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-(2-フタロイルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 1.50 g、4-(2-ピリジル)安息香酸 285 mg およびカルボニルジイミダゾール 255 mg を用い、実施例 1 に準じて反応および後処理を行なうと、ガム状の目的化合物 984 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0395】1.14 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.47-1.73 (4H, m), 2.50-2.70 (4H, m), 2.80-2.92 (1H, m), 3.89 (2H, dt, $J=5.0, 5.0$ Hz), 4.04 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.15- (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.67 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10-7.20 (3H, m), 7.20-7.31 (3H, m), 7.73-7.79 (2H, m), 7.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例 4 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 9-35)

実施例 3 で得られた 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 767 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 2.86 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行ない、ジイソプロピルエーテルと酢酸エチルの混合溶媒で結晶化すると、無色結晶の目的化合物 361 mg が得られた。

1) 融点 114-116℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ

(233)

463

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0396】 1.50-1.79 (4H, m), 2.57-2.75 (4H, m), 2.80-2.94 (1H, m), 3.85 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.13-4.20 (2H, m), 6.69 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.20 (3H, m), 7.22-7.32 (3H, m), 7.70-7.84 (4H, m), 7.97 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.67-8.71 (1H, m)。

実施例5 2-(2-フェノキシエチル)-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 138-2のエチルエステル)

4-(2-ピリジル)安息香酸 279mg を無水ジクロロメタン 8ml に懸濁し、この懸濁液にカルボニルジイミダゾール 272mg を加え、室温で30分間攪拌し、均一の溶液とした。この溶液に、参考例3で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(2-フェノキシエチル)プロピオン酸エチル 476mg を塩化メチレン 5ml に溶解した溶液を加え、室温で30分間攪拌し、一晩放置した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加えた。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ジクロロメタン:酢酸エチル=1:1)に付して精製すると、ガム状の目的化合物 374mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0397】 1.14 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.90-2.21 (2H, m), 2.76-3.10 (3H, m), 3.87-4.19 (8H, m), 6.65-6.69 (1H, m), 6.82-6.89 (4H, m), 6.93 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.32 (3H, m), 7.76-7.83 (2H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72-8.75 (1H, m)。

実施例6 2-(2-フェノキシエチル)-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 138-2)

実施例5で得られた2-(2-フェノキシエチル)-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 350mg をエタノール 8ml に溶解し、この溶液に85%水酸化カリウム 0.13g を加え、80℃で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物よりエタノールを減圧留去した後、1N塩酸 2.0ml および酢酸エチルを加えた。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮すると泡状の目的化合物 260mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

464

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0398】 1.93-2.22 (2H, m), 2.78-3.02 (3H, m), 3.86 (2H, dt, J=5.0, 5.5 Hz), 4.00-4.08 (2H, m), 4.16-4.21 (2H, m), 6.65-6.69 (1H, m), 6.82-6.97 (5H, m), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22-7.34 (3H, m), 7.72-7.85 (4H, m), 7.97 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.68-8.71 (1H, m)。

10 【0399】得られた目的化合物をエタノール 3ml に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 0.51ml を加え、濃縮し、得られた固体をジエチルエーテルで洗浄すると無定形固形の目的化合物のナトリウム塩 203mg が得られた。

実施例7 2-フェノキシ-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 6-35のエチルエステル)

参考例4で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 660mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 428mg およびカルボニルジイミダゾール 418mg を用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 367mg が得られた。

1) 融点 118.5-120℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

30 【0400】 1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.17-3.22 (2H, m), 3.89 (2H, dt, J=5.0, 5.5 Hz), 4.13-4.22 (4H, m), 4.74 (1H, dd, J=5.5, 7.0 Hz), 6.63-6.69 (1H, m), 6.84 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.87 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.94 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.20-7.30 (5H, m), 7.75-7.80 (2H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例8 2-フェノキシ-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 6-35)

40 実施例7で得られた2-フェノキシ-3-[4-(2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 327mg および85%水酸化カリウム 200mg を用い、実施例6に準じて反応および後処理を行ない、次いでジイソプロピルエーテルとヘキサンの混合溶媒で結晶化すると、無色結晶の目的化合物 280mg が得られた。

1) 融点 149-151℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

50 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル

(234)

465

(270 MHz) は次の通りである。

【0401】3.21 (2H, d, J=7.0 Hz), 3.87 (2H, dt, J=5.0, 5.5 Hz), 4.14-4.18 (2H, m), 4.73 (1H, t, J=7.0 Hz), 6.84-6.94 (6H, m), 7.19-7.31 (5H, m), 7.75-7.80 (2H, m), 7.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例9 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-35のエチルエステル)

参考例5で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 13.52 g、4-(2-ピリジル)安息香酸 7.97 g およびカルボニルジイミダゾール 6.49 g を用い、実施例5に準じて反応および後処理を行ない、次いでジイソプロピルエーテルで結晶化すると、無色結晶の目的化合物 8.38 g が得られた。

1) 融点 77-79℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0402】1.14-1.25 (9H, m), 2.72-2.90 (1H, m), 3.12-3.19 (2H, m), 3.89 (2H, dt, J=5.0, 5.5 Hz), 4.11-4.22 (4H, m), 4.69 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.65 (1H, brt), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20-7.31 (3H, m), 7.76-7.81 (2H, m), 7.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.69-8.75 (1H, m)。

実施例10 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-35)

実施例9で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 8.38 g および1N水酸化ナトリウム水溶液 30.32 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 7.95 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0403】1.16 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.70-2.88 (1H, m), 3.19 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.80-3.89 (2H, m), 4.11-4.18 (2H, m), 4.77 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.77-6.88 (5H, m), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.70 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.75-7.86 (3H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz),

466

8.70-8.77 (1H, m)。

実施例11 2-ブチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-35のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 1.49 g、4-(2-ピリジル)安息香酸 996 mg およびカルボニルジイミダゾール 810 mg を用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 1.04 g が得られた。

1) 融点 112-115℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0404】0.86 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.37 (4H, m), 1.39-1.68 (2H, m), 2.35-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.89 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.66 (1H, brs), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21-7.31 (1H, m), 7.77-7.79 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例12 2-ブチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 4-35)

実施例11で得られた2-ブチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 0.92 g および1N水酸化ナトリウム水溶液 3.80 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 1.06 g が得られた。

1) 融点 137-139℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0405】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.42 (4H, m), 1.45-1.70 (2H, m), 2.57-2.80 (1H, m), 2.70 (1H, dd, J=5.0, 13.5 Hz), 2.87 (1H, dd, J=9.0, 13.5 Hz), 3.86 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.17 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.77 (1H, brs), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.38 (1H, m), 7.72-7.75 (2H, m), 7.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例13 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

(235)

467

(例示化合物番号 37-3のエチルエステル)
 参考例7で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル 796mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 438mgおよびカルボニルジイミダゾール 428mgを用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 285mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0406】 1.05 (3H, s), 1.24 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.38-1.80 (4H, m), 2.56-2.65 (3H, m), 2.94 (1H, d, $J=13.0$ Hz), 3.89 (2H, dt, $J=5.0, 5.5$ Hz), 4.07-4.18 (4H, m), 6.65 (1H, brs), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.14-7.30 (6H, m), 7.75-7.79 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例14 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号 37-3)

実施例13で得られた2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 131mgおよび85%水酸化カリウム 0.24gを用い、実施例6に準じて反応および後処理を行なった。得られた残留物を更にシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=20:

1)に付した後、1N水酸化ナトリウム水溶液 0.37mlを加え、濃縮し、得られた固体をジイソプロピルエーテルで洗浄すると、白色粉末の目的化合物のナトリウム塩 117mgが得られた。

1) 融点 108-111°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0407】 1.01 (3H, s), 1.15-1.85 (4H, m), 2.55-2.78 (3H, m), 3.03 (1H, d, $J=13.0$ Hz), 3.71-3.93 (2H, m), 4.13-4.38 (2H, m), 6.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.69 (8H, m), 8.08-8.45 (6H, m), 8.86-8.98 (1H, m), 9.09-9.15 (1H, m)。

実施例15 2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 33-3のエチルエステル)

参考例8で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸

468

エチル 760mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 460mgおよびカルボニルジイミダゾール 440mgを用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 930mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0408】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 3.11 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.29 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.89 (2H, dt, $J=5.0, 5.5$ Hz), 4.10-4.25 (2H, m), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.71 (1H, brs), 6.75-6.86 (4H, m), 6.97 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 7.13-7.33 (5H, m), 7.74-7.84 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例16 2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 33-3)

20 実施例15で得られた2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 930mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 3.60mlを用い、実施例2に準じて70°Cで反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 545mgが得られた。

1) 融点 76-79°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0409】 1.44 (3H, s), 3.15 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.28 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.87 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.16 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.75 (1H, brs), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.92 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.97 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 7.15-7.34 (5H, m), 7.70-7.88 (4H, m), 7.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.73 (1H, d, $J=4.0$ Hz)。

実施例17 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 34-3のエチルエステル)

参考例9で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 510mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 279mgおよびカルボニルジイミダゾール 272mgを用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 487mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

(236)

469

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0410】1.19 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.23 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.37 (3H, s), 2.83 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.10 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.26 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.90 (2H, dt, J=5.0, 5.0 Hz), 4.17 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 6.69 (1H, brt, J=5.0 Hz), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.32 (1H, m), 7.76-7.79 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71-8.73 (1H, m)。

実施例18 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 34-3)

実施例17で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 486mgおよび85%水酸化カリウム 0.17gを用い、実施例6に準じて反応および後処理を行ない、次いでジイソプロピルエーテルで洗浄すると、白色粉末の目的化合物 335mgが得られた。

1) 融点 141-143℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0411】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.43 (3H, s), 2.84 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.15 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.25 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.83-3.93 (2H, m), 4.17 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.70 (1H, brt, J=6.0 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.27-7.33 (1H, m), 7.72-7.80 (2H, m), 7.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例19 2-ブチル-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 30-3のエチルエステル)

参考例10で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチル-2-メチルプロピオン酸エチル 2.42g、4-(2-ピリジル)安息香酸 1.72gおよびカルボニルジイミダゾール 1.69gを用い、実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 970mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシ

470

ラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0412】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.06 (3H, s), 1.12-1.46 (8H, m), 1.60-1.77 (1H, m), 2.63 (1H, d, J=13.5 Hz), 2.97 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.86-3.93 (2H, m), 4.07-4.18 (4H, m), 6.68 (1H, brt, J=5.0 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.03 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24-7.31 (1H, m), 7.76-7.80 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71-8.73 (1H, m)。

実施例20 2-ブチル-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 30-3)

実施例19で得られた2-ブチル-2-メチル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 350mg、1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlおよび85%水酸化カリウム 0.10gを用い、実施例6に準じて反応および後処理を行なった。得られた残留物を更に更にシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン：メタノール=19：1）に付した後、ジイソプロピルエーテル-ヘキサンの混合溶液で洗浄すると、白色粉末の目的化合物 133mgが得られた。

1) 融点 105.5-107.5℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0413】0.91 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.09 (3H, s), 1.20-1.48 (5H, m), 1.66-1.78 (1H, m), 2.64 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.00 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.83-3.93 (2H, m), 4.09-4.18 (2H, m), 6.79-6.83 (1H, m), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.32 (1H, m), 7.73-7.83 (2H, m), 7.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.03 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例21 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-15のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 666mg、ビフェニル-4-カルボン酸 450mgおよびカルボニルジイミダゾール 442mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、黄色粉末の目的化合物 705mgが得られた。

1) 融点 89-90℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシ

(237)

471

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0414】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.32 (4H, m), 1.40-1.69 (2H, m), 2.53-2.63 (1H, m), 2.69 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.07 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.63 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.37-7.50 (3H, m), 7.60-7.68 (4H, m), 7.86 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 22 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-ブチルプロピオン酸 (例示化合物番号 4-15)

実施例 21 で得られた 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 450 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 3.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 388 mg が得られた。

1) 融点 130-131°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0415】0.88 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.25-1.43 (4H, m), 1.46-1.73 (2H, m), 2.58-2.66 (1H, m), 2.72 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.89 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.87 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.71 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.35-7.49 (3H, m), 7.58-7.70 (4H, m), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 23 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-179 のエチルエステル)

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 540 mg、4'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸 420 mg およびカルボニルジイミダゾール 370 mg を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 486 mg が得られた。

1) 融点 121-123°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0416】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.38 (4H, m), 1.42-1.70 (2H, m), 2.51-2.72 (2H, m), 2.80-2.92 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.87-3.92 (2H, m), 4.07 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.

472

14 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.62 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.55 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.62 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.83 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 24 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 4-179)

実施例 23 で得られた 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 400 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 4.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行うと、淡橙色粉末の目的化合物 350 mg が得られた。

1) 融点 166.5-168°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0417】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.23-1.40 (4H, m), 1.43-1.71 (2H, m), 2.57-2.78 (2H, m), 2.85-2.97 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.82-3.90 (2H, m), 4.13 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.69 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.55 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.81 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 25 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-206 のエチルエステル)

4'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸 383 mg をジクロロメタン 10 ml に懸濁し、室温にて、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 359 mg および 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール・一水和物 287 mg を加え、4 時間攪拌した。この反応液に参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 500 mg を溶解したジクロロメタン溶液 10 ml を加え、室温にて 2 時間攪拌後、一晚放置した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加えた。酢酸エチル層を分離し、0.5 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン: 酢酸エチル = 5:1) に付して精製すると、無色油状の目的化合物 270 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

(238)

473

【0418】0.86 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.37 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.55-2.64 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.36 (1H, brs), 6.65 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.49 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例26 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-206)

実施例25で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 260 mgおよび1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.20 mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 230 mgが得られた。

1) 融点 182-184℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0419】0.79 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.15 1.30 (4H, m), 1.34-1.53 (2H, m), 2.40-2.50 (1H, m), 2.57 (1H, dd, J=6.0, 13.5 Hz), 2.71 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.59 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.05 (2H, t, J=5.5 Hz), 6.83 (4H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.53 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.63 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.63 (1H, t, J=5.5 Hz), 9.61 (1H, s)。

実施例27 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-207)

参考例11で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 1.88 gおよび1 N水酸化ナトリウム水溶液 6.80 mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、薄褐色固体の2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 1.78 gが得られた。本化合物 521 mgをアセトン15 mlに溶解し、水0.17 mlを加えた。室温にて、アンバーリスト15 1000 mgをこの溶液に加え、40分間放置した。アンバーリスト15を濾去後、反応液を濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (ジクロロメタン: メタノール=20:1) にて精製すると、白色固体の目的物336 mgが得られた。

474

1) 融点 122-124℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0420】0.88 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.37 (4H, m), 1.40-1.59 (1H, m), 1.61-1.71 (1H, m), 2.58-2.69 (1H, m), 2.72 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.90 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.71 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.97 (2H, d, J=8.5 Hz), 10.08 (1H, s)。

実施例28 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-211)

実施例27で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 366 mgをエタノール10 mlに溶解した。この溶液に、室温にて、95%水素化ホウ素ナトリウム 34 mgを加え、1時間30分間攪拌した。反応終了後、50%酢酸を反応液に加えた後、反応溶液を減圧濃縮した。得られた残留物に酢酸エチルおよび水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残留物にジイソプロピルエーテルを加えると、無色結晶の目的物331 mgが得られた。

1) 融点 111-113℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0421】0.88 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.39 (4H, m), 1.40-1.65 (2H, m), 2.52-2.61 (1H, m), 2.67 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.0, 13.5 Hz), 3.80 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.68 (2H, s), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.46 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.63 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例29 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメチルアミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-208)

実施例27で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 474 mgをエタ

(239)

475

ノール20mlに懸濁した。この懸濁液に、室温にて、トリエチルアミン0.56ml、ジメチルアミン・塩酸塩167mg、チタンテトライソプロポキシド0.59mlを加え均一の溶液とした。この溶液に水素化ホウ素ナトリウム60mgを加え、窒素雰囲気下、18時間攪拌した。反応終了後、50%酢酸を反応液に加えた後、反応溶液を減圧濃縮した。得られた残留物に酢酸エチルおよび水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残留物にジイソプロピルエーテルを加えると、無色結晶の目的物135mgが得られた。

1) 融点 125-127℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400MHz) は次の通りである。

【0422】0.87 (3H, t, $J=6.5$ Hz), 1.22-1.38 (4H, m), 1.41-1.62 (2H, m), 2.50-2.59 (1H, m), 2.66 (1H, dd, $J=6.0, 13.5$ Hz), 2.82 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 2.86 (6H, s), 3.78 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.33 (2H, s), 6.87 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.60 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.93 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例30 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-210) -

参考例12で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシカルボニルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル243mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液1.83mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物163mgが得られた。

1) 融点 199-201℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0423】0.83 (3H, t, $J=6.5$ Hz), 1.18-1.31 (4H, m), 1.37-1.52 (2H, m), 2.40-2.50 (1H, m), 2.61 (1H, dd, $J=6.0, 13.5$ Hz), 2.74 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.66 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.10 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 6.87 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.87 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.05 (2H, dd, $J=2.5, 8.5$ Hz), 8.78 (1H, d, $J=5.5$ Hz)。

実施例31 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メ

476

トキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-212のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル620mg、3'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸456mgおよびカルボニルジイミダゾール389mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物740mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0424】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.31 (4H, m), 1.41-1.68 (2H, m), 2.53-2.64 (1H, m), 2.69 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.87 (3H, s), 3.88 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.05 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.62 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.92-6.95 (1H, m), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11-7.14 (1H, m), 7.18-7.21 (1H, m), 7.38 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.65 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例32 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-212)

実施例31で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル730mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液4.50mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物520mgが得られた。

1) 融点 107-109℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0425】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.38 (4H, m), 1.45-1.71 (2H, m), 2.58-2.67 (1H, m), 2.71 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.90 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.83-3.90 (5H, m), 4.13 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.71 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.93 (1H, dd, $J=2.5, 8.0$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.12 (1H, d, $J=2.5$ Hz), 7.18 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.37 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.64 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例33 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-213のエチルエステル)

(240)

477

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 678mg、参考例13で得られた3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸 450mg、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 443mgおよび1-ヒドロキシベンズトリアゾール・一水和物 354mgを用いて、実施例25に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 291mgが得られた。

1) 融点 76-77.5℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0426】0.86 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.36 (4H, m), 1.40-1.69 (2H, m), 2.52-2.65 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.89 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.06 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.10 (1H, s), 6.70 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.83-6.91 (1H, m), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09-7.16 (2H, m), 7.31 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.58 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例34 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-213)

実施例33で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 350mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.85mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 290mgが得られた。

1) 融点 98-100℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0427】0.84-0.89 (3H, m), 1.21-1.40 (4H, m), 1.45-1.68 (2H, m), 2.51-2.90 (3H, m), 3.80-3.88 (2H, m), 4.12-4.20 (2H, m), 6.82-6.92 (3H, m), 7.04-7.15 (4H, m), 7.27 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.55-7.70 (3H, m), 7.90 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.91-9.08 (1H, brs)。

実施例35 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-214)

参考例14で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニル

478

アミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

1.46gおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 5.40mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 1.39gが得られた。本化合物 365mgを用い、実施例27に準じて反応および後処理を行なうと、黄褐色固体の目的化合物 335mgが得られた。

10 1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0428】0.88 (3H, t, $J=6.5$ Hz), 1.18-1.38 (4H, m), 1.40-1.78 (2H, m), 2.61-2.68 (1H, m), 2.73 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.92 (1H, dd, $J=8.0, 13.5$ Hz), 3.89 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.69 (1H, brt), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.64 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.69 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.86-7.91 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.12 (1H, s), 10.10 (1H, s)。

実施例36 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ヒドロキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号4-218)

参考例15で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 23.8mgをエタノール2.0mlに懸濁した。この懸濁液に、室温にて、4N塩化水素・ジオキサン溶液 1.2mlを加え、1晩放置した。反応終了

後、反応溶液を減圧濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルおよび水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=20:1~10:1) にて精製後ナトリウム塩とすると、黄褐色固体の目的物 140mgが得られた。1) 融点 124-126℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0429】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.18-1.39 (4H, m), 1.44-1.63 (2H, m), 2.32-2.47 (1H, m), 2.51 (1H, dd, $J=7.0, 13.5$ Hz), 2.85 (1H, dd, $J=6.0, 13.5$ Hz), 3.76 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.68 (2H, s), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.36 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.44 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.56 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.66 (1

(241)

479

H, s), 7.72 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例37 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-214のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 683mg、3'-ホルミルビフェニル-4-カルボン酸 635mgおよびカルボニルジイミダゾール 500mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、薄茶色油状の目的化合物 506mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0430】0.86 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.39 (4H, m), 1.41-1.73 (2H, m), 2.53-2.66 (1H, m), 2.69 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.90 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.64 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.64 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.86-7.92 (2H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.12 (1H, s), 10.10 (1H, s)。

実施例38 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメチルアミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-215のエチルエステル)

実施例37で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 415mg、トリエチルアミン 0.23ml、ジメチルアミン・塩酸塩 139mg、チタンテトライソプロポキシド 0.49mlおよび水素化ホウ素ナトリウム 56mgを用い、実施例29に準じて反応および後処理を行なうと、無色シロップ状の目的化合物 263mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0431】0.86 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.37 (4H, m), 1.39-1.75 (2H, m), 2.23 (6H, s), 2.55-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.52 (2H, s), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.63 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.34 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.42 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.

480

52 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.58 (1H, s), 7.68 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.84 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例39 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメチルアミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-215)

実施例38で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメチルアミノメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 263mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 121mgが得られた。

1) 融点 95-97°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0432】0.86 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.14-1.34 (4H, m), 1.35-1.61 (2H, m), 2.46-2.57 (1H, m), 2.62 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.77 (6H, s), 2.81 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.76 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.25 (2H, s), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.49 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.57 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.74-7.79 (1H, m), 7.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (1H, s), 7.91 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例40 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-217のエチルエステル)

実施例37で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 390mgをアセトニトリル 6mlに溶解した。この溶液に水 0.3mlおよびリン酸二水素ナトリウム・ニ水合物 24mgを加えた。この溶液に氷冷下30%過酸化水素水 0.12ml、水 0.3mlに溶解した亜塩素酸ナトリウムmgを加え、同温にて1時間、室温にて2時間30分攪拌した。反応溶液にチオ硫酸ナトリウムを添加し反応を停止した後に、酢酸エチルおよび水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残留物にジイソプロピルエーテルを加えると、白色固体の目的物 217mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0433】0.86 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.15 (3H, t,

(242)

481

J=7.0 Hz), 1.20-1.39 (4H, m), 1.40-1.51 (1H, m), 1.53-1.68 (1H, m), 2.51-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, d, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.83-3.95 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.12-4.20 (2H, m), 6.70 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.53-7.61 (1H, m), 7.63-7.77 (2H, m), 7.79-7.94 (3H, m), 8.08-8.19 (1H, m), 8.36 (1H, s)。

実施例41 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-217)

実施例40で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-カルボキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 273 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 1.10 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 196 mg が得られた。

1) 融点 142-143℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0434】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.44 (4H, m), 1.44-1.65 (2H, m), 2.49-2.60 (1H, m), 2.66 (1H, dd, J=6.0, 13.5 Hz), 2.82 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.77 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.58 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.90 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.04 (1H, d, J=7.5 Hz), 8.30 (1H, s), 8.72 (1H, brt)。

実施例42 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-219のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 643 mg、2'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸 500 mg およびカルボニルジイミダゾール 426 mg を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、淡黄色油状の目的化合物 750 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0435】0.91 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.28-1.40 (4H, m), 1.45-1.73 (2H, m), 2.59-2.79 (2H, m), 2.85-2.97 (1H,), 3.86 (3H, s), 3.93 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.10 (2H, q, J=7.0 Hz),

482

4.18 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.67 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, t, J=8.0 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.35-7.44 (2H, m), 7.65 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.86 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例43 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-219)

実施例42で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 750 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 5.00 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、淡橙色粉末の目的化合物 625 mg が得られた。

1) 融点 190-192℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0436】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.38 (4H, m), 1.43-1.71 (2H, m), 2.58-2.78 (2H, m), 2.85-2.97 (1H, m), 3.80 (3H, s), 3.87 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.67 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.98-7.06 (2H, m), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.28-7.38 (2H, m), 7.59 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.81 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例44 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-220のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 249 mg、参考例16で得られた2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸 200 mg、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 195 mg および1-ヒドロキシベンズトリアゾール・一水和物 138 mg を用いて、実施例25に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 386 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0437】0.87 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.32 (4H, m), 1.40-1.69 (2H, m), 2.53-2.72 (2H, m), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.01-4.18 (4H, m), 5.27 (1H, s), 6.61-6.69 (1H, m), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.95-7.11 (4H, m), 7.21-7.28 (2H, m), 7.58 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.88 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例45 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ヒ

(243)

483

ドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号4-220)

実施例44で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 345 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.82 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理、分取薄層クロマトグラフィー (展開溶液 ジクロロメタン: メタノール=10:1) を行った後ナトリウム塩とし、無色結晶の目的化合物 200 mg が得られた。

1) 融点 153-156℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸として重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0438】0.88 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.25-1.37 (4 H, m), 1.44-1.71 (2H, m), 2.55-2.78 (2H, m), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.83 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.10 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.69-6.79 (1H, m), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.95-7.10 (4H, m), 7.22-7.30 (2H, m), 7.55 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例46 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-221のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ) フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 414 mg、2'-ホルミルビフェニル-4-カルボニル酸 350 mg およびカルボニルジイミダゾール 296 mg を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 314 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0439】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.19-1.33 (4H, m), 1.41-1.68 (2H, m), 2.53-2.72 (2H, m), 2.87 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.91 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.01-4.20 (4H, m), 6.65-6.72 (1H, m), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.42-7.59 (4H, m), 7.63-7.70 (1H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.04 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 9.96 (1H, s)。

実施例47 2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ]

484

フェニル] プロピオン酸 (例示化合物番号4-221)

実施例46で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(2'-ホルミルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 314 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.50 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理、分取薄層クロマトグラフィー (展開溶液 ジクロロメタン: メタノール=10:1) を行なうと、フォーム状の目的化合物 152 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0440】0.86 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.40 (4 H, m), 1.42-1.70 (2H, m), 2.55-2.78 (2H, m), 2.88 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.83-3.93 (2H, m), 4.07-4.18 (2H, m), 6.81 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.95-7.06 (1H, m), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.38-7.46 (3H, m), 7.48-7.56 (1H, m), 7.61-7.69 (1H, m), 7.89 (2 H, d, $J=8.0$ Hz), 8.02 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 9.92 (1H, s)。

実施例48 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ヒドロキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号4-205)

参考例17で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸 1.00 g および4 N塩化水素・ジオキサン溶液 0.69 ml を用い、実施例36に準じて反応および後処理を行なうと、薄茶色固体の目的化合物 28 mg が得られた。

1) 融点 137-139℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム-重メタノール (10:3) の混合溶液中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0441】0.85 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.40 (5 H, m), 1.43-1.60 (1H, m), 2.27 (6H, s), 2.34-2.47 (1H, m), 2.52 (1H, dd, $J=7.5$, 13.5 Hz), 2.85 (1H, dd, $J=7.5$, 13.5 Hz), 3.74 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.13 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.62 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.84 (2 H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例49 2-ブチル-3-[4-[2-(2-ヒドロキシピリジン-5-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-193のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)

(244)

485

フェニル] - 2-ブチルプロピオン酸エチル 843 mg、6-ヒドロキシニコチン酸 400 mg、1-(3-ジメチルアミノプロピル) - 3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 660 mg および 1-ヒドロキシベンズトリアゾール・一水和物 528 mg を用いて、実施例 25 に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 636 mg が得られた。

1) 融点 102-104℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0442】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.17 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.32 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.53-2.72 (2H, m), 2.80-2.91 (1H, m), 3.81 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.02-4.12 (4H, m), 6.42-6.52 (1H, m), 6.56 (1H, d, $J=9.5$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.80 (1H, dd, $J=2.5$, 9.5 Hz), 8.00 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例 50 2-ブチル-3-[4-[2-(2-ヒドロキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 4-193)

実施例 49 で得られた 2-ブチル-3-[4-[2-(2-ヒドロキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 300 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 3.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、淡黄色粉末の目的化合物 240 mg が得られた。

1) 融点 6.9-7.1℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0443】0.90 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.30-1.45 (4H, m), 1.50-1.79 (2H, m), 2.57-2.68 (1H, m), 2.77 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.68-3.77 (2H, m), 4.00-4.09 (2H, m), 6.42 (1H, d, $J=10.0$ Hz), 6.71 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.05 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10-7.20 (1H, m), 7.75-7.80 (2H, m)。

実施例 51 2-ブチル-3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-96 のエチルエステル)

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 766 mg、6-メトキシニコチン酸 400 mg およびカルボニルジイミダゾール 508 mg を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 783 mg が得られた。

1) 融点 129-130℃

486

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0444】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.33 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.52-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.85 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.00 (3H, s), 4.06 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.12 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.46-6.55 (1H, m), 6.78 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.99 (1H, dd, $J=2.5$, 8.5 Hz), 8.59 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例 52 2-ブチル-3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 4-96)

実施例 51 で得られた 2-ブチル-3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 4.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 293 mg が得られた。

1) 融点 144-145℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0445】0.89 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.24-1.40 (4H, m), 1.47-1.75 (2H, m), 2.62-2.90 (3H, m), 3.71-3.97 (2H, m), 3.98 (3H, s), 4.11-4.26 (2H, m), 6.48-6.60 (1H, m), 6.78 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.03 (1H, dd, $J=2.5$, 8.5 Hz), 8.31 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例 53 2-ブチル-3-[4-[2-(2-イソプロポキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 4-98 のエチルエステル)

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 156 mg、参考例 18 で得られた 6-イソプロポキシニコチン酸 106 mg およびカルボニルジイミダゾール 112 mg を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 170 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0446】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.40 (10H, m), 1.41-1.71 (2H, m), 2.61-2.73 (2H, m), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz)

(245)

487

z), 3.83 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.11 (2H, t, J=5.0 Hz), 5.35 (2H, septet, J=6.0 Hz), 6.56-6.62 (1H, m), 6.69 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.97 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 8.58 (1H, d, J=2.5 Hz)。

実施例54 2-ブチル-3-[4-[2-(2-イソプロポキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-98)

実施例53で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(2-イソプロポキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 170 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 0.75 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 137 mg が得られた。

1) 融点 117-118℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0447】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.40 (9H, m), 1.46-1.80 (3H, m), 2.59-2.82 (2H, m), 2.85 (1H, dd, J=9.0, 13.5 Hz), 3.73-3.96 (2H, m), 4.10-4.22 (2H, m), 5.31 (2H, septet, J=6.0 Hz), 6.48-6.57 (1H, m), 6.70 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.00 (1H, d, J=2.5, 8.5 Hz), 8.35 (1H, d, J=2.5 Hz)。

実施例55 2-ブチル-3-[4-[2-(2-フェノキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-106のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 158 mg、6-フェノキシニコチン酸 125 mg およびカルボニルジイミダゾール 112 mg を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 225 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0448】0.86 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.36 (4H, m), 1.41-1.70 (2H, m), 2.52-2.72 (2H, m), 2.85 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.78-3.89 (2H, m), 4.01-4.15 (4H, m), 6.65-6.82 (3H, m), 6.92 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.20-7.26 (1H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 8.12 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 8.58 (1H, d, J=2.5 Hz)。

488

実施例56 2-ブチル-3-[4-[2-(2-フェノキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-106)

実施例55で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(2-フェノキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 215 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 1.32 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理、分取薄層クロマトグラフィー (展開溶液 ジクロロメタン: メタノール=10:1) を行なうと、無色結晶の目的化合物 137 mg が得られた。

1) 融点 124-125℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0449】0.85-0.95 (3H, m), 1.25-1.39 (4H, m), 1.40-1.71 (2H, m), 2.53-2.88 (3H, m), 3.70-3.97 (2H, m), 4.08-4.28 (2H, m), 6.58-6.68 (1H, m), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20-7.29 (1H, m), 7.39-7.48 (2H, m), 8.15 (1H, dd, J=8.5 Hz), 8.29 (1H, s)。

実施例57 2-ブチル-3-[4-[2-(キノリン-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-150のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 529 mg、キノリン-3-カルボン酸 312 mg およびカルボニルジイミダゾール 350 mg を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、黄色油状の目的化合物 760 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0450】0.87 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.37 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.69 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.95 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.76-6.82 (1H, m), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.63 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.78-7.85 (1H, m), 7.92 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.16 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.60 (1H, d, J=2.5 Hz), 9.28 (1H, d, J=2.5 Hz)。

実施例58 2-ブチル-3-[4-[2-(キノリン-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号4-150)

(246)

489

実施例57で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(キノリン-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 760mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 6.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 386mgが得られた。

1) 融点 245-248℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

2-ブチル-3-[4-[2-(キノリン-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸として重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。 0.90 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.28-1.48 (4H, m), 1.50-1.80 (2H, m), 2.58-2.90 (3H, m), 3.80-4.07 (2H, m), 4.20-4.39 (2H, m), 6.68-6.84 (1H, m), 6.87 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.62 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.81 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.91 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.13 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.70 (1H, s), 8.81 (1H, s)。

実施例59 2-ブチル-3-[4-[2-(インドール-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-143のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 546mg、インドール-3-カルボン酸 300mg、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 428mgおよび1-ヒドロキシベンゾトリアゾール・水和物 342mgを用いて、実施例25に準じて反応および後処理を行い、黄色油状の目的化合物 650mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0451】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.15 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.32 (4H, m), 1.40-1.68 (2H, m), 2.55-2.64 (1H, m), 2.69 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.91 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.05 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.17 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.44 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24-7.29 (2H, m), 7.41-7.45 (1H, m), 7.74 (1H, d, $J=3.0$ Hz), 7.95-7.99 (1H, m), 8.59-8.70 (1H, m)。

実施例60 2-ブチル-3-[4-[2-(インドール-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-143)

実施例59で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(インドール-3-カルボニルアミノ)エトキシ]フェ

490

ニル]プロピオン酸エチル 650mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 5.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 500mgが得られた。

1) 融点 171-173℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0452】0.86 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.37 (4H, m), 1.40-1.68 (2H, m), 2.40-2.62 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.90 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.88 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.17 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.73 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17-7.24 (2H, m), 7.42-7.47 (1H, m), 7.78 (1H, d, $J=3.0$ Hz), 8.00-8.05 (1H, m)。

実施例61 2-ブチル-3-[4-[2-(4-N, N-ジエチルアミノベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号4-230のエチルエステル)

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 455mg、4-N, N-ジエチルアミノ安息香酸 300mgおよびカルボニルジイミダゾール 302mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 346mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0453】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.13-1.20 (9H, m), 1.24-1.37 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.53-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5, 13.5$ Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5, 13.5$ Hz), 3.39 (4H, q, $J=7.0$ Hz), 3.83 (2H, q, $J=5.5$ Hz), 4.01-4.14 (4H, m), 6.40 (1H, t, $J=5.5$ Hz), 6.63 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.66 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例62 2-ブチル-3-[4-[2-(4-N, N-ジエチルアミノベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号4-230)

実施例61で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4-N, N-ジエチルアミノベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 340mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.20mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 257mgが得られた。

1) 融点 76-78℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

(247)

491

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0454】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.17 (6H, t, J=7.0 Hz), 1.11-1.21 (4H, m), 1.45-1.70 (2H, m), 2.57-2.65 (1H, m), 2.70 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.90 (1H, dd, J=8.0, 13.5 Hz), 3.38 (4H, q, J=7.0 Hz), 3.80 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.08 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.48 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.62 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例63 2-ブチル-3-[4-[2-(4-ピペリジン-1-イルベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル（例示化合物番号4-229のエチルエステル）

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 428mg、4-ピペリジン-1-イル安息香酸 300mgおよびカルボニルジイミダゾール 284mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 420mgが得られた。

1) 融点 87-89℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0455】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.37 (4H, m), 1.40-1.73 (8H, m), 2.52-2.61 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.26-3.33 (4H, m), 3.83 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.01-4.16 (4H, m), 6.48 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.67 (2H, d, J=9.0 Hz)。

実施例64 2-ブチル-3-[4-[2-(4-ピペリジン-1-イルベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸（例示化合物番号4-229）

実施例63で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(4-ピペリジン-1-イルベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 370mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.30mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 324mgが得られた。

1) 融点 112.5-114℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0456】0.90 (3H, t, J=6.5 Hz), 1.28-1.44 (4H, m), 1.48-1.77 (8H, m), 2.61-2.69 (1H, m), 2.73

492

(1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.92 (1H, dd, J=8.0, 13.5 Hz), 3.27-3.33 (4H, m), 3.84 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.11 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.54 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.89 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.70 (2H, d, J=9.0 Hz)。

実施例65 2-ブチル-3-[4-[2-[N-(3-フェニルプロピル)-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル（例示化合物番号20-71のエチルエステル）

参考例19で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3-フェニルプロピルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 460mgおよび4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 341mgをジクロロメタン 10mlに懸濁後、室温にてトリエチルアミン 0.37mlを滴下した。同温にて5時間攪拌後、溶媒を減圧留去した。得られた残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン:メタノール=19:1）にて精製すると、無色油状の目的化合物 275mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0457】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.12-2.05 (11H, m), 2.42-2.91 (5H, m), 3.35-4.30 (8H, m), 6.70-6.88 (2H, m), 7.00-7.60 (10H, m), 7.73-7.85 (2H, m), 7.99-8.06 (2H, m), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例66 2-ブチル-3-[4-[2-[N-(3-フェニルプロピル)-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸・塩酸塩（例示化合物番号20-71）

実施例65で得られた2-ブチル-3-[4-[2-[N-(3-フェニルプロピル)-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 275mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行った後、4N塩化水素・ジオキサン溶液を用い塩酸塩とし、泡状の目的化合物 230mgが得られた。1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

2-ブチル-3-[4-[2-[N-(3-フェニルプロピル)-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸として、重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0458】0.92 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.30-1.45 (4H, m), 1.50-2.10 (4H, m), 2.55-2.82 (5H, m), 3.48

(248)

493

-3.83 (4H, m), 4.00-4.36 (2H, m), 6.57-6.86 (2H, m), 7.02-7.39 (10H, m), 7.68-7.89 (4H, m), 8.69 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例67 2-ブチル-3-[4-[2-[N-ブチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号20-53のエチルエステル)

参考例20で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(ブチルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 390mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 340mgおよびトリエチルアミン 0.37mlを用いて、実施例65に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物165mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0459】0.78-1.71 (19H, m), 2.55-2.77 (2H, m), 2.82-2.91 (1H, m), 3.34-3.47 (1H, m), 3.65-3.80 (3H, m), 3.83-3.94 (1H, m), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.23-4.32 (1H, m), 6.68-6.91 (2H, m), 7.01-7.15 (2H, m), 7.23-7.30 (1H, m), 7.43-7.81 (4H, m), 8.02 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70 (0.6H, d, J=5.0 Hz), 8.90 (0.4H, d, J=5.0 Hz)。

実施例68 2-ブチル-3-[4-[2-[N-ブチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸・塩酸塩 (例示化合物番号20-53)

実施例67で得られた2-ブチル-3-[4-[2-[N-ブチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル165mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行った後、4N塩化水素・ジオキサン溶液を用い塩酸塩とし、泡状の目的化合物 110mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 2-ブチル-3-[4-[2-[N-ブチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸として、重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0460】0.80-1.01 (6H, m), 1.10-1.85 (10H, m), 2.60-2.85 (3H, m), 3.30-3.90 (4H, m), 4.11-4.38 (2H, m), 6.58-6.90 (2H, m), 7.02-7.14 (2H, m), 7.28-7.40 (3H, m), 7.68-7.90 (4H, m), 8.69 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例69 2-ブチル-3-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]プロポキシ]フェニル]

494

ル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号40-3のエチルエステル)

参考例21で得られた3-[4-(3-アミノプロポキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 500mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 340mgおよびカルボニルジイミダゾール 333mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 178mg が得られた。1) 融点 110-112℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0461】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.33 (4H, m), 1.42-1.70 (2H, m), 2.14 (2H, quintuplet, J=6.0 Hz), 2.53-2.73 (2H, m), 2.80-2.91 (1H, m), 3.71 (2H, q, J=6.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.13 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.76-6.80 (1H, m), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.32 (1H, m), 7.76-7.81 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.73 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例70 2-ブチル-3-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノプロポキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号40-3)

実施例69で得られた2-ブチル-3-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノプロポキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 161mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.20mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 117mg が得られた。

1) 融点 151-152℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0462】0.90 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.28-1.44 (4H, m), 1.51-1.64 (1H, m), 1.65-1.78 (1H, m), 2.15 (2H, quintuplet, J=6.0 Hz), 2.58-2.92 (3H, m), 3.60-3.80 (2H, m), 4.15-4.21 (2H, m), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87-6.95 (1H, m), 7.16 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.30-7.35 (1H, m), 7.74-7.90 (6H, m), 8.69 (1H, d, J=5.5 Hz)。

実施例71 2-ブチル-3-[4-[3-[N-メチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]プロポキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号20-80のエチルエステル)

参考例22で得られた2-ブチル-3-[4-(3-メチルアミノプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 380mg 4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライ

(249)

495

ド・塩酸塩 360mg およびトリエチルアミン 0.40ml を用いて、実施例65に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 259mg が得られた。

1) 融点 58-60℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0463】0.86 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.15 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.38 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 1.96-2.23 (2H, m), 2.52-2.72 (2H, m), 2.80-2.91 (1H, m), 3.00-3.19 (3H, m), 3.49-3.60 (1H, m), 3.71-3.89 (2H, m), 4.00-4.12 (3H, m), 6.61-6.70 (1H, m), 6.79-6.89 (1H, m), 6.99-7.10 (2H, m), 7.23-7.28 (1H, m), 7.41-7.55 (2H, m), 7.70-7.81 (2H, m), 7.91-8.06 (2H, m), 8.71 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例72 2-ブチル-3-[4-[3-[N-メチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]プロポキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号20-80)

実施例71で得られた2-ブチル-3-[4-[3-[N-メチル-4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノ]プロポキシ]フェニル]プロピオン酸エチル200mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 1.20ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 127mg が得られた。

1) 融点 110-112℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0464】0.91 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.41 (4H, m), 1.48-1.61 (1H, m), 1.64-1.83 (1H, m), 1.93-2.23 (2H, m), 2.58-2.83 (3H, m), 3.00-3.17 (3H, m), 3.37-3.60 (1H, m), 3.68-4.26 (3H, m), 6.66-7.01 (2H, m), 7.10-7.30 (2H, m), 7.33-7.60 (3H, m), 7.70-8.20 (4H, m), 8.76-9.05 (1H, m)。

実施例73 2-プロピル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号3-35のエチルエステル)

参考例23で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-プロピルプロピオン酸エチル 2.20g を4N塩化水素・ジオキサン溶液 30ml に溶解し、室温にて40分間放置した。反応液を減圧濃縮後、過剰の塩酸をトルエンにて共沸除去した。この様にして得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-プロピルプロピオン酸エチル・塩酸塩、4-(2-ピリジル)安息香酸 1.

496

21g およびトリエチルアミン 1.80ml をN, N-ジメチルホルムアミド 8.0ml に溶解し、氷冷下、シアノリン酸ジエチル 0.97ml を溶解したN, N-ジメチルホルムアミド溶液 4.0ml を滴下し、同温にて1時間、室温にて3時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン: 酢酸エチル=7:3) にて精製すると、淡黄色粉末の目的化合物 2.20g が得られた。

1) 融点 90.5-92℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0465】0.88 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.71 (4H, m), 2.50-2.72 (2H, m), 2.80-2.92 (1H, m), 3.81-3.95 (2H, m), 4.00-4.21 (4H, m), 6.60-6.71 (1H, m), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20-7.31 (1H, m), 7.70-7.80 (2H, m), 7.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例74 2-プロピル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号3-35)

実施例73で得られた2-プロピル-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 2.10g および1N水酸化ナトリウム水溶液 15.0ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 1.96g が得られた。

1) 融点 81-82.5℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0466】0.90 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.71 (4H, m), 2.55-2.75 (2H, m), 2.75-2.92 (1H, m), 3.74-3.90 (2H, m), 4.03-4.21 (2H, m), 6.71-6.89 (3H, m), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.31 (1H, m), 7.66-7.83 (4H, m), 7.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例75 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号6-15のエチルエステル) 参考例4で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 666mg、ビフェニル-4-カルボン酸 400mg およびカルボニルジイミダゾール 393mg

(250)

497

を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 280mg が得られた。

1) 融点 103-104.5℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0467】1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.15-3.22 (2H, m), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13-4.22 (4H, m), 4.74 (1H, dd, J=6.0, 7.5 Hz), 6.62 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.84 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.87 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.94 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.19-7.25 (4H, m), 7.35-7.50 (3H, m), 7.57-7.63 (2H, m), 7.65 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例76 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号6-15)

実施例75で得られた3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 270mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 250mg が得られた。

1) 融点 171-173℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0468】3.20 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.82-3.90 (2H, m), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.71 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.86 (4H, d, J=8.0 Hz), 6.91 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.01-7.12 (1H, m), 7.18-7.27 (4H, m), 7.35-7.50 (3H, m), 7.61 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.88 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例77 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号6-190のエチルエステル)

参考例4で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.63g、4'-フルオロビフェニル-4-カルボン酸 1.20g およびカルボニルジイミダゾール 1.08g を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 915mg が得られた。

1) 融点 99-101℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0469】1.25 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.22-3.26 (2

498

H, m), 3.94 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.20 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.67 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.86-6.93 (4H, m), 6.96-7.01 (1H, m), 7.19 (2H, t, J=8.5 Hz), 7.28 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.59-7.68 (4H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例78 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号6-190)

実施例77で得られた3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 915mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 5.00ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 866mg が得られた。

1) 融点 195-196℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0470】3.08-3.17 (2H, m), 3.63 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.83-4.89 (1H, m), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.88-6.95 (3H, m), 7.23-7.39 (6H, m), 7.73-7.84 (4H, m), 7.95 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.75 (1H, t, J=5.5 Hz)。

実施例79 3-[4-[2-(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号6-204のエチルエステル)

参考例4で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.50g、4'-クロロビフェニル-4-カルボン酸 1.17g およびトリエチルアミン 0.70ml をテトラヒドロフラン20ml に溶解し、氷冷下、シアノリン酸ジエチル 0.76ml を溶解したテトラヒドロフラン溶液 10ml を滴下した。同温にて1時間、室温にてさらに4時間攪拌後、溶媒を減圧留去した。得られた残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン: 酢酸エチル=19:1) にて精製すると、淡黄色油状の目的化合物 0.90g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0471】1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.12-3.21 (2H, m), 3.79-3.90 (2H, m), 4.05-4.21 (4H, m), 4.69

(251)

499

-4.79 (1H, m), 6.68-6.78 (1H, m), 6.80-6.89 (4H, m), 6.90-6.96 (1H, m), 7.16-7.27 (4H, m), 7.41 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.51 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.58 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.84 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 80 3-[4-[2-(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号 6-204)

実施例 79 で得られた 3-[4-[2-(4'-クロロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 900 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 5.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 638 mg が得られた。

1) 融点 194.5-197℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0472】3.05-3.15 (2H, m), 3.58-3.67 (2H, m), 4.01-4.12 (2H, m), 4.80-4.89 (1H, m), 6.78-6.95 (5H, m), 7.18-7.28 (4H, m), 7.55 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.71-7.81 (4H, m), 7.96 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.71-8.79 (1H, m)。

実施例 81 3-[4-[2-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号 6-191 のエチルエステル)

参考例 4 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.60 g、4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボン酸 1.30 g およびカルボニルジイミダゾール

0.95 g を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、淡黄色油状の目的化合物 1.10 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0473】1.25 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.18-3.25 (2H, m), 3.95 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.20 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.70 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.82-6.98 (5H, m), 7.20-7.32 (4H, m), 7.65-7.76 (6H, m), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 82 3-[4-[2-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号 6-191)

実施例 81 で 3-[4-[2-(4'-トリフルオロメ

500

チルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.10 g および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 5.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 850 mg が得られた。

1) 融点 217-218.5℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0474】3.06-3.16 (2H, m), 3.66 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.11 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.85 (1H, dd, J=5.0, 7.5 Hz), 6.80-6.96 (5H, m), 7.20-7.28 (4H, m), 7.85 (4H, d, J=8.5 Hz), 7.94-8.02 (4H, m), 8.80 (1H, t, J=5.5 Hz)。

実施例 83 3-[4-[2-(4'-ヒドロキシ-3',5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号 6-205)

参考例 24 で得られた 3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3',5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 330 mg および 4 N 塩化水素・ジオキサン溶液 3.30 ml を用い、実施例 36 に準じて反応および後処理を行ない、ナトリウム塩として白色粉末の目的化合物 257 mg が得られた。

1) 融点 134-135℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0475】2.23 (6H, s), 2.90 (1H, dd, J=9.5, 14.5 Hz), 3.05 (1H, dd, J=1.5, 14.5 Hz), 3.61 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.07 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.32 (1H, dd, J=1.5, 9.5 Hz), 6.74 (2H, d, J=7.5 Hz), 6.78 (1H, d, J=7.5 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.31 (2H, s), 7.66 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.54 (1H, brs), 8.68 (1H, brt)。

実施例 84 3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号 6-96 のエチルエステル)

参考例 4 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 753 mg、6-メトキシニコチン酸 350 mg およびカルボニルジイミダゾール 445 mg を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 355 mg が得られた。

1) 融点 114-116℃

(252)

501

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0476】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.17-3.20 (2H, m), 3.85 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.98 (3H, s), 4.12 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.73 (1H, dd, $J=6.0, 7.0$ Hz), 6.48 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.77 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.82-6.86 (4H, m), 6.94 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.20-7.28 (4H, m), 7.98 (1H, d, $J=2.5, 8.5$ Hz), 8.59 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例85 3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号6-96)

実施例84で得られた3-[4-[2-(2-メトキシピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 330 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.50 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 260 mg が得られた。

1) 融点 145-146.5°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0477】3.18-3.23 (2H, m), 3.81 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.97 (3H, s), 4.14 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.71 (1H, dd, $J=5.5, 7.0$ Hz), 6.76 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.93 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.02-7.11 (1H, m), 7.17-7.27 (4H, m), 8.02 (1H, dd, $J=2.5, 8.5$ Hz), 8.60 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例86 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-15のエチルエステル)

参考例25で得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 723 mg、ビフェニル-4-カルボン酸 303 mg、シアノリン酸ジエチル 0.25 ml およびトリエチルアミン 0.47 ml を用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、黄色油状の目的化合物 630 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0478】1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.15-3.20

502

(2H, m), 3.89 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.20 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 6.64 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.35-7.51 (3H, m), 7.59-7.63 (2H, m), 7.66 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例87 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号7-15)

実施例86で得られた3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 630 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.00 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 510 mg が得られた。

1) 融点 172-173°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0479】1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.21 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 3.86 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.12 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.78 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.68 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.35-7.49 (3H, m), 7.57-7.62 (2H, m), 7.65 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

実施例88 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-179のエチルエステル)

参考例25で得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 723 mg、4'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸 350 mg、シアノリン酸ジエチル 0.25 ml およびトリエチルアミン 0.47 ml を用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 600 mg が得られた。

1) 融点 116-117°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0480】1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.15-3.21

(253)

503

(2H, m), 3.86 (3H, s), 3.86-3.91 (2H, m), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.69 (1H, dd, J=6.0, 7.0 Hz), 6.62 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.99 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.55 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.61 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.83 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例 89 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-179)

実施例 88 で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(4'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 580 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 2.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 450 mg が得られた。

1) 融点 159-160°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0481】1.18 (6H, d, J=6.5 Hz), 2.77-2.80 (1H, m), 3.18-3.27 (2H, m), 3.80-3.90 (5H, m), 4.10-4.18 (2H, m), 4.76-4.82 (1H, m), 6.67-6.70 (1H, m), 6.78 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.98 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.54 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.59 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.81 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例 90 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-190 のエチルエステル)

参考例 25 で得られた 3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 723 mg、4'-フルオロビフェニル-4-カルボン酸 331 mg、シアノリン酸ジエチル 0.25 ml およびトリエチルアミン 0.47 ml を用いて、実施例 73 に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 460 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0482】1.18 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.82 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.12-3.18 (2H, m), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13 (2H, t, J=5.

504

0 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.69 (1H, dd, J=6.0, 7.0 Hz), 6.63 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.00-7.29 (6H, m), 7.53-7.60 (2H, m), 7.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.84 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例 91 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号 7-190)

10 実施例 90 で得られた 3-[4-[2-(4'-フルオロビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 450 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 2.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 380 mg が得られた。

1) 融点 192-193°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0483】1.17 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.84 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.18 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.84 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.66 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.77 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.19 (2H, m), 7.22-7.33 (3H, m), 7.55-7.62 (4H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz)。

30 実施例 92 3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-212 のエチルエステル)

参考例 25 で得られた 3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 723 mg、3'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸 350 mg、シアノリン酸ジエチル 0.25 ml およびトリエチルアミン 0.47 ml を用いて、実施例 73 に準じて反応および後処理を行い、淡黄色油状の目的化合物 700 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0484】1.22 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.24 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.85 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.18-3.25 (2H, m), 3.91 (3H, s), 3.92-3.99 (2H, m), 4.12-4.28 (4H, m), 4.73 (1H, dd, J=6.0, 7.0 Hz), 6.62-6.70 (1H, m), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.97 (1H, dd, J=2.5, 8.0 Hz), 7.12 (2H,

(254)

505

d, J=8.5 Hz), 7.17 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.20-7.30 (3H, m), 7.41 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.88 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例93 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号7-212)

実施例92で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(3'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 700mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 3.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 310mgが得られた。

1) 融点 138-139℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0485】1.24 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.89 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.27 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.93 (3H, s), 3.84-3.96 (2H, m), 4.18 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.85 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.74 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.99 (1H, dd, J=2.5, 8.0 Hz), 7.16 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20-7.27 (2H, m), 7.29 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.44 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例94 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-219のエチルエステル)

参考例25で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 723mg、2'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸 350mg、シアノリン酸ジエチル 0.25mlおよびトリエチルアミン 0.47mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 710mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0486】1.18 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.82 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.15-3.20 (2H, m), 3.81 (3H, s), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.66-4.72 (1H, m), 6.62 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.98-7.10

506

(4H, m), 7.21-7.38 (4H, m), 7.60 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.81 (2H, d, J=8.0 Hz)。

実施例95 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号7-219)

実施例94で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 700mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 3.60mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行ない、ナトリウム塩として白色粉末の目的化合物 528mgが得られた。

1) 融点 205-208℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2'-メトキシビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸として重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0487】1.18 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.82 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.21 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.80 (3H, s), 3.86 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.12 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.78 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.66 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.78 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.97-7.07 (2H, m), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.28-7.37 (2H, m), 7.59 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.80 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例96 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2'-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-95のエチルエステル)

参考例5で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 743mg、6-フェニルニコチン酸 438mgおよびカルボニルジイミダゾール 357mgを用いて実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 196mgが得られた。

1) 融点 113-114℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0488】1.10-1.23 (9H, m), 2.72-2.88 (1H, m), 3.12-3.19 (2H, m), 3.82-3.93 (2H, m), 4.10-4.23 (4H, m), 4.69 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.61-6.69 (1H, m), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.41-7.53 (3H, m), 7.81 (1H, d, J=8.5 Hz),

(255)

507

8.00-8.08 (2H, m), 8.12-8.20 (1H, m), 9.01-9.39 (1H, m)。

実施例97 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号7-95)

実施例96で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(2-フェニルピリジン-5-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 169mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液

0.60mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物126mgが得られた。

1) 融点 174-176℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0489】1.19 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.79-2.90 (1H, m), 3.27 (2H, d, J=5.5 Hz), 3.71-3.88 (1H, m), 3.88-4.01 (1H, m), 4.28-4.40 (2H, m), 4.94 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.50-6.59 (1H, m), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.30 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.42-7.49 (3H, m), 7.75-7.81 (1H, m), 7.85-7.92 (2H, m), 8.25-8.31 (2H, m)。

実施例98 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-233のエチルエステル)

参考例5で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 743mg、参考例26で得られた6-(4-メトキシフェニル)ニコチン酸 504mgおよびカルボニルジイミダゾール 357mgを用いて実施例5に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物182mgが得られた。

1) 融点 100-101℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0490】1.13-1.23 (9H, m), 2.74-2.89 (1H, m), 3.12-3.19 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.86-3.93 (2H, m), 4.11-4.23 (4H, m), 4.69 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.59-6.65 (1H, m), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.74 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.13 (1

508

H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 9.01 (1H, d, J=2.0 Hz)。

実施例99 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号7-233)

実施例98で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 170mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液0.58mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物153mgが得られた。

1) 融点 166-167℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0491】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.78-2.90 (1H, m), 3.27 (2H, d, J=5.5 Hz), 3.86 (3H, s), 3.70-4.01 (2H, m), 4.29-4.39 (2H, m), 4.95 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.43-6.51 (1H, m), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.90-7.00 (4H, m), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.30 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.73 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.80-7.88 (2H, m), 8.19 (1H, d, J=2.5 Hz), 8.27 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz)。

実施例100 3-[4-[2-[2-(4-フルオロフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-233-1のエチルエステル)

参考例25で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 718mg、参考例27で得られた6-(4-フルオロフェニル)ニコチン酸 330mg、シアノリン酸ジエチル0.25mlおよびトリエチルアミン0.47mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物560mgが得られた。

1) 融点 117-118℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0492】1.18 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.21 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.82 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.15-3.20 (2H, m), 3.90 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13-4.22 (4H, m), 4.69 (1H, dd, J=5.5, 7.0 Hz), 6.66 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.14-7.25 (4H, m), 7.76 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.00-8.07 (2H, m), 8.16

(256)

509

(1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 9.03 (1H, d, J=2.0 Hz)。

実施例101 3-[4-[2-[2-(4-フルオロフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号7-231)

実施例100で得られた3-[4-[2-[2-(4-フルオロフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 540mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 3.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 495mgが得られた。

1) 融点 199-200°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0493】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.84 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.20-3.23 (2H, m), 3.86 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.21 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.70 (1H, dd, J=5.5, 7.0 Hz), 6.80 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13-7.30 (4H, m), 7.79 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.92 (1H, t, J=5.5 Hz), 8.03-8.09 (2H, m), 8.25 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 9.12 (1H, d, J=2.0 Hz)。

実施例102 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-236のエチルエステル)

参考例5で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 500mg、参考例28で得られた6-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ニコチン酸 375mgおよびカルボニルジイミダゾール 240mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 137mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0494】1.11-1.28 (9H, m), 2.82 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.10-3.20 (2H, m), 3.83 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.08-4.25 (4H, m), 4.68-4.87 (3H, m), 5.99 (1H, tt, J=4.5, 5.3 Hz), 6.63-6.89 (6H, m), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 8.58 (1H, d, J=2.5 Hz)。

実施例103 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボ

510

ニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸・ナトリウム塩 (例示化合物番号7-236)

実施例102で得られた3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 73mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.13mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 51mgが得られた。

1) 融点 204-207°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0495】1.11-1.21 (6H, m), 2.77 (1H, septet, J=7.0 Hz), 2.99-3.17 (2H, m), 3.73 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.12 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.78-4.90 (3H, m), 6.30 (1H, tt, J=5.0, 5.3 Hz), 6.74 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.13 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 8.64 (1H, d, J=2.5 Hz)。

実施例104 (S)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号7-35の光学活性体)

参考例29で得られた(S)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸 2-トリメチルシリルエチル 562mgをテトラヒドロフラン4.0mlに溶解した。この溶液に、室温にて1Mテトラブチルアンモニウムフルオリド・テトラヒドロフラン溶液 2.25mlを加え、1時間攪拌した。反応液を濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を0.5N塩酸および飽和食塩水にて洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶液ジクロロメタン:メタノール=5:1) にて精製、ジイソプロピルエーテルから結晶化すると、無色結晶の目的化合物 278mgが得られた。

1) 融点 100-101°C

2) $[\alpha]_D^{25} +13.9^\circ$ (c=0.9、クロロホルム)

3) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz) は次の通りである。

【0496】1.11 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.74 (1H, sep

(257)

511

tet, $J=7.0$ Hz), 3.02-3.16 (2H, m), 3.73-3.82 (2H, m), 3.98-4.07 (2H, m), 4.63-4.74 (1H, m), 6.69-6.80 (4H, m), 6.95-7.01 (3H, m), 7.11 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.25-7.31 (1H, m), 7.68 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.72-7.85 (3H, m), 7.93 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.69 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例 105 (R)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-35 の光学活性体)

参考例 30 で得られた (R)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイル]アミノエトキシ]フェニル]プロピオン酸 2 トリメチルシリルエチル 270 mg および 1 M テトラブチルアンモニウムフルオライド・テトラヒドロフラン溶液 1.08 ml を用いて、実施例 104 に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 117 mg が得られた。

1) 融点 95-96°C

2) $[\alpha]_D^{25} -10.9^\circ$ ($c=1.5$, クロロホルム)

3) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400 MHz) は次の通りである。

【0497】1.11 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.73 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.02-3.16 (2H, m), 3.73-3.82 (2H, m), 3.98-4.07 (2H, m), 4.63-4.74 (1H, m), 6.69-6.80 (4H, m), 6.95-7.02 (3H, m), 7.12 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.25-7.31 (1H, m), 7.65 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.72-7.83 (3H, m), 7.88 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 8.70 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例 106 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-227 のエチルエステル)

参考例 31 で得られた 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)安息香酸 546 mg をトルエン 28.0 ml に溶解し、室温にて、この溶液に N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴およびチオニルクロライド 0.75 ml を加え、85°C にて 4 時間攪拌後、溶媒を減圧留去した。トルエンを用い過剰のチオニルクロライドを共沸除去後、減圧下乾燥した。得られた残留物および参考例 5 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 201 mg をジクロロメタン 10 ml に溶解し、氷冷下、この溶液にトリエチルアミン 1.23 ml を加えた。同温にて 30 分攪拌後、反応液を濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチ

512

ル層を分離し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=3:2~1:1) にて精製すると、フォーム状黄色固体の目的化合物 570 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

10 【0498】1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.81 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.17 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.90 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 4.70 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.67 (1H, brt), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.88 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.01 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.99 (1H, s)。

実施例 107 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-227)

実施例 106 で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 1.60 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 38.3 mg が得られた。

1) 融点 212-214°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0499】1.13 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.78 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.07 (1H, d, $J=7.0$ Hz), 3.09 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.64 (2H, q, $J=5.5$ Hz), 4.11 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.77 (1H, dd, $J=5.0, 7.0$ Hz), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.27 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.30-8.36 (2H, m), 8.84 (1H, brt), 9.08 (1H, s)。

実施例 108 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ニトロピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-228 のエチルエステル)

参考例 32 で得られた 4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸 277 mg、参考例 5 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-

(258)

513

イソプロピルフェノキシ) - プロピオン酸エチル 290 mg、シアノリン酸ジエチル 0.18 ml およびトリエチルアミン 0.29 ml を用い、実施例 79 に準じて反応および後処理を行うと、シロップ状の目的化合物 379 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0500】 1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.17 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.18 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.90 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.06-4.39 (4H, m), 4.69 (1H, dd, $J=5.0$, 7.5 Hz), 6.68 (1H, brt), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.13 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.93 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.95 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.56 (1H, dd, $J=2.0$, 8.5 Hz), 9.51 (1H, d, $J=2.0$ Hz)。

実施例 109 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ニトロピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-228)

実施例 108 で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-ニトロピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 379 mg および 1N 水酸化ナトリウム水溶液 1.30 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 216 mg が得られた。

1) 融点 $-19.8 \sim -19.9^\circ\text{C}$

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0501】 1.13 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.79 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.07 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.09 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 3.65 (2H, q, $J=5.5$ Hz), 4.11 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.78 (1H, dd, $J=5.5$, 7.5 Hz), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.04 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.31 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.36 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.70 (1H, dd, $J=2.0$, 8.5 Hz), 8.86 (1H, brt), 9.47 (1H, d, $J=2.0$ Hz)。

実施例 110 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-メトキシピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号 7-222 のエチルエステル)

参考例 33 で得られた 4-(5-メトキシピリジン-2

514

イル)安息香酸 195 mg、チオニルクロライド 0.31 ml、参考例 5 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-プロピオン酸エチル 301 mg およびトリエチルアミン 0.36 ml を用い、実施例 106 に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の目的化合物 199 mg が得られた。

1) 融点 $118 \sim 119^\circ\text{C}$

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

10 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0502】 1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.23 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.16 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.18 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.89 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.92 (3H, s), 4.15 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.0$, 7.5 Hz), 6.63 (1H, brt), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.28 (1H, dd, $J=3.0$, 8.5 Hz), 7.71 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.01 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=3.0$ Hz)。

実施例 111 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-メトキシピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号 7-222)

実施例 110 で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(5-メトキシピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 210 mg および 1N 水酸化ナトリウム水溶液 0.72 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 185 mg が得られた。

1) 融点 $145 \sim 146^\circ\text{C}$

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

40 【0503】 1.19 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.83 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.22 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 3.88 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.91 (3H, s), 4.20 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.82 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.65 (1H, brt), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.32 (1H, dd, $J=3.0$, 9.0 Hz), 7.67 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.41 (1H, d, $J=3.0$ Hz)。

実施例 112 3-[4-[2-[4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)

50

(259)

515

プロピオン酸エチル (例示化合物番号7-225のエチルエステル)

参考例34で得られた4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)安息香酸 221mg、チオニルクロライド 0.34ml、参考例5で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 370mgおよびトリエチルアミン 0.51mlを用い、実施例106に準じて反応および後処理を行うと、フォーム状固体の目的化合物 456mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0504】1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.04 (6H, s), 3.16 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.17 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.88 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.0$, 7.5 Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (1H, dd, $J=2.5$, 9.0 Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.45 (1H, br t), 7.64 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.00 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.23 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

実施例113 3-[4-[2-[4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号7-225) -

実施例112で得られた3-[4-[2-[4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 429mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.44mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 219mgが得られた。

1) 融点 150-151°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム: 重メタノール (1:5) の混合溶液中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0505】1.15 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.77 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.04 (6H, s), 3.10 (1H, dd, $J=8.5$, 14.5 Hz), 3.15 (1H, dd, $J=4.5$, 14.5 Hz), 3.76 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.58 (1H, dd, $J=4.5$, 8.5 Hz), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.87 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22 (1H, dd, $J=3.0$, 9.0 Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.72 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.85-7.95 (4H, m), 8.11 (1

516

H, d, $J=3.0$ Hz)。

実施例114 2-(4-メチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号14-11のエチルエステル)

参考例35で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル 798mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 365mg、シアノリン酸ジエチル 0.28mlおよびトリエチルアミン 0.46mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 680mgが得られた。1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0506】1.23 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.28 (3H, s), 3.14-3.22 (2H, m), 3.88-3.96 (2H, m), 4.11-4.27 (4H, m), 4.73 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.62-6.71 (1H, m), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.05 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22-7.33 (3H, m), 7.78-7.83 (2H, m), 7.92 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71-8.78 (1H, m)。

実施例115 2-(4-メチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号14-11)

実施例114で得られた2-(4-メチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 680mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.60mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 570mgが得られた。

1) 融点 129-131°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0507】2.25 (3H, s), 3.21 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 3.81-3.90 (2H, m), 4.15-4.21 (2H, m), 4.80 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.68-6.75 (1H, m), 6.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.03 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.29-7.36 (1H, m), 7.70-7.88 (4H, m), 7.92 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.69-8.73 (1H, m)。

実施例116 2-(4-t-ブチルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-8のエチルエステル)

(260)

517

参考例 36 で得られた 3- [4- (2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ) フェニル] -2- (4-*t*-ブチルフェノキシ) プロピオン酸エチル 500 mg、4- (2-ピリジル) 安息香酸 227 mg、シアノリン酸ジエチル 0.18 ml およびトリエチルアミン 0.33 ml を用いて、実施例 73 に準じて反応および後処理を行い、フォーム状の目的化合物 370 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0508】 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.25 (9H, s), 3.15-3.20 (2H, m), 3.89 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.10-4.22 (4H, m), 4.69 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 6.66 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23-7.30 (5H, m), 7.74-7.80 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例 117 2- (4-*t*-ブチルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸 (例示化合物番号 138-8)

実施例 116 で得られた 2- (4-*t*-ブチルフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 360 mg および 1N 水酸化ナトリウム水溶液 2.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 315 mg が得られた。

1) 融点: 94-96°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0509】 1.24 (9H, s), 3.20 (2H, d, $J=6.0$ Hz), 3.80-3.90 (2H, m), 4.13-4.20 (2H, m), 4.79 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.76 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.22 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.25 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.28-7.35 (1H, m), 7.70-7.90 (4H, m), 7.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.73 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例 118 2- (4-フルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例示化合物番号 138-56 のエチルエステル)

参考例 37 で得られた 3- [4- (2-アミノエトキシ) フェニル] -2- (4-フルオロフェノキシ) プロピオン酸エチル 2.10 g、4- (2-ピリジル) ベンゾイルクロライド・塩酸塩 1.90 g およびトリエ

518

チルアミン 2.20 ml を用いて、実施例 65 に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 2.50 g が得られた。

1) 融点: 116-118°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0510】 1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.17 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.80-3.91 (2H, m), 4.08-4.21 (4H, m), 4.66 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.62-6.70 (1H, m), 6.70-6.80 (2H, m), 6.80-6.92 (4H, m), 7.20-7.30 (3H, m), 7.71-7.80 (2H, m), 7.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例 119 2- (4-フルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸 (例示化合物番号 138-56)

実施例 118 で得られた 2- (4-フルオロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 2.45 g および 1N 水酸化ナトリウム水溶液 15.0 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 2.30 g が得られた。

1) 融点: 139-140.5°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0511】 3.20 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.80-3.91 (2H, m), 4.16-4.22 (2H, m), 4.74 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.69-6.77 (1H, m), 6.77-6.92 (6H, m), 7.19 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.30-7.37 (1H, m), 7.69-7.80 (3H, m), 7.80-7.90 (3H, m), 8.71 (1H, d, $J=4.0$ Hz)。

実施例 120 2- (4-クロロフェノキシ) -3- [4- [2- [4- (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例示化合物番号 138-72 のエチルエステル)

参考例 38 で得られた 3- [4- (2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ) フェニル] -2- (4-クロロフェノキシ) プロピオン酸エチル 1.14 g、4- (2-ピリジル) 安息香酸 539 mg、シアノリン酸ジエチル 0.41 ml およびトリエチルアミン 0.68 ml を用いて、実施例 73 に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 977 mg が得られた。1) 融点: 134-135°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル

(261)

519

(270 MHz) は次の通りである。

【0512】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.83-3.92 (2H, m), 4.08-4.21 (4H, m), 4.69 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.60-6.68 (1H, m), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13-7.30 (5H, m), 7.72-7.79 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70-8.73 (1H, m)。

実施例121 2-(4-クロロフェノキシ)-3-[4-[2-(4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-72)

実施例120で得られた2-(4-クロロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 950 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 3.49 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 834 mg が得られた。

1) 融点 155-156℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0513】3.21 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.80-3.90 (2H, m), 4.12-4.22 (2H, m), 4.76 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.70-6.88 (5H, m), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.30-7.38 (1H, m), 7.70-7.90 (6H, m), 8.70-8.74 (1H, m)。

実施例122 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-24のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 332 mg、4-トリフルオロメチルフェノール 186 mg およびトリフェニルホスフィン 300 mg をトルエン 10 ml に溶解し、室温下、40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.52 ml を溶解したトルエン溶液 3.0 ml を滴下した。室温にて2時間攪拌後、反応液にトリフェニルホスフィン100 mg および40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.19 ml を追加し、さらに18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン: 酢酸エチル=3:2) にて精製すると、白色粉末の目的化合物 (若干の不純物を含む) 283 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

520

【0514】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.21 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.77 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.66 (1H, brt), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.26-7.34 (1H, m), 7.49 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.75-7.83 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例123 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号138-24)

実施例122で得られた3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピオン酸エチル 269 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 0.55 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 138 mg が得られた。

1) 融点 154-155℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0515】3.02 (1H, dd, J=5.0, 13.5 Hz), 3.16 (1H, dd, J=2.0, 13.5 Hz), 3.63 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.64 (1H, dd, J=2.0, 5.0 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.41 (1H, dd, J=6.0, 7.5 Hz), 7.54 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.88-7.97 (1H, m), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, d, J=7.5 Hz), 8.18 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.70 (1H, d, J=3.5 Hz), 8.78 (1H, brt)。

実施例124 2-(4-メトキシフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号8-35のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 433 mg、4-メトキシフェノール 247 mg、トリフェニルホスフィン 523 mg をおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.65 ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、黄色油状の目的化合物 320 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0516】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.17 (2H, d,

(262)

521

J=6.5 Hz), 3.72 (3H, s), 3.89 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.10-4.21 (4H, m), 4.63 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.66 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.30 (1H, m), 7.40-7.70 (4H, m), 7.75-7.80 (2H, m), 7.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz).

実施例125 2-(4-メトキシフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号8-35)

実施例124で得られた2-(4-メトキシフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 310mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 150mgが得られた。

1) 融点 67.5-70℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0517】 3.20 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.73 (3H, s), 3.82-3.92 (2H, m), 4.16-4.25 (2H, m), 4.74 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.65-6.90 (7H, m), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.27-7.37 (1H, m), 7.70-7.89 (4H, m), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz).

実施例126 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-40のエチルエステル)

参考例40で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル 2.11gを4N塩化水素・ジオキサン溶液 30mlに溶解し、室温にて40分間放置した。反応液を減圧濃縮後、過剰の塩酸をトルエンにて共沸除去した。この様にして得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル・塩酸塩および4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 1.25gをジクロロメタン 70mlに懸濁し、氷冷下、トリエチルアミン 2.28mlを加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=2:3) にて精製すると、無色結晶の目的化合物 1.75gが得られた。1) 融点 87-8

522

8℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0518】 1.17 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.18 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.10-4.25 (4H, m), 4.70 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.65 (1H, brt), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.14-7.31 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.72-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz).

実施例127 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号138-40)

実施例126で得られた3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル 1.65gおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 5.54mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 1.33gが得られた。

1) 融点 180-181℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0519】 3.16 (1H, dd, J=8.0, 14.5 Hz), 3.22 (1H, dd, J=4.5, 14.5 Hz), 3.78 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.83 (1H, dd, J=4.5, 8.0 Hz), 6.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.36-7.45 (1H, m), 7.88-7.99 (2H, m), 7.94 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.64 (1H, d, J=5.0 Hz), 8.77 (1H, brt).

実施例128 2-(4-シアノフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-104のエチルエステル)

参考例41で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-シアノフェノキシ)プロピオン酸エチル 237mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 131mgおよびトリエチルアミン 0.29mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、シロップ状の目的化合物 244mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシ

(263)

523

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0520】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.21 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.65 (1H, brt), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24-7.31 (1H, m), 7.54 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.70-7.84 (2H, m), 7.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例129 2-(4-シアノフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-104)

実施例128で得られた2-(4-シアノフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 244 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 0.92 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 184 mg が得られた。

1) 融点 92-93°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0521】3.24 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.86 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.15-4.25 (2H, m), 4.85 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.76 (1H, brt), 6.85 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.37 (1H, dd, J=5.0, 6.0 Hz), 7.48 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.73 (3H, d, J=8.0 Hz), 7.84 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.87 (1H, dd, J=6.0, 8.0 Hz), 8.71 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例130 2-(4-メチルチオフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-120のメチルエステル)

参考例42で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メチルチオフェノキシ)プロピオン酸メチル 265 mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 175 mg およびトリエチルアミン 0.32 ml を用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 164 mg が得られた。

1) 融点 94-95°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0522】2.41 (3H, s), 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.71 (3H, s), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H,

524

t, J=5.0 Hz), 4.72 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.66 (1H, brt), 6.77 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.23-7.30 (1H, m), 7.73-7.84 (2H, m), 7.88 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例131 2-(4-メチルチオフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-120)

実施例130で得られた2-(4-メチルチオフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 203 mg および1 N水酸化ナトリウム水溶液 0.74 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 153 mg が得られた。

1) 融点 168-169°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0523】2.40 (3H, s), 3.22 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.87 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.21 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.80 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.72 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.34 (1H, dd, J=5.0, 7.0 Hz), 7.74 (1H, dd, J=7.0, 7.5 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.83 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例132 2-(4-メタンсульホニルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-136のメチルエステル)

参考例43で得られた3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メタンсульホニルフェノキシ)プロピオン酸メチル 387 mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 219 mg およびトリエチルアミン 0.44 ml を用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 278 mg が得られた。

1) 融点 80-81°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0524】2.99 (3H, s), 3.23 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.74 (3H, s), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.85 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.65 (1H, brt), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (2H, d, J=9.0 Hz)

(264)

525

z), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.38 (1H, m), 7.74-7.82 (2H, m), 7.82 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.73 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例133 2-(4-メタンスルホニルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-136)

実施例132で得られた2-(4-メタンスルホニルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 263mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.94mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物195mgが得られた。

1) 融点 231-233℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0525】 3.03-3.24 (2H, m), 3.13 (3H, s), 3.64 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.5 Hz), 5.10 (1H, dd, J=4.5, 7.5 Hz), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.25 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=5.0, 7.5 Hz), 7.78 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.92 (1H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70 (1H, d, J=5.0 Hz), 8.78 (1H, t, J=5.5 Hz)。

実施例134 2-[4-(2-ピリジル)フェノキシ]-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-264のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 370mg、4-(2-ピリジル)フェノール 292mg、トリフェニルホスフィン 447mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.56mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 500mgが得られた。1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0526】 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.22 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.82 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.66 (1H, t, J=5.0 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.30 (3H, m),

526

7.45-7.80 (5H, m), 7.89 (4H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.63 (1H, d, J=4.5 Hz), 8.71 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例135 2-[4-(2-ピリジル)フェノキシ]-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-264)

実施例134で得られた2-[4-(2-ピリジル)フェノキシ]-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物390mgが得られた。

1) 融点 98-101℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

20 【0527】 3.08-3.22 (2H, m), 3.60-3.70 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 4.90-5.00 (1H, m), 6.92 (2H, d, J=7.5 Hz), 6.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.27 (3H, d, J=7.5 Hz), 7.40 (1H, t, J=6.0 Hz), 7.50-7.70 (1H, m), 7.77-8.10 (7H, m), 8.18 (2H, d, J=7.5 Hz), 8.60 (1H, d, J=4.0 Hz), 8.70 (1H, d, J=5.0 Hz), 8.75-8.82 (1H, m)。

実施例136 2-(3-フルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-88のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500mg、3-フルオロフェノール 258mg、トリフェニルホスフィン 604mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.75mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物524mgが得られた。

1) 融点 133-134.5℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

40 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0528】 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.18 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.81-3.92 (2H, m), 4.10-4.22 (4H, m), 4.72 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.51-6.70 (4H, m), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11-7.30 (4H, m), 7.71-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

50 実施例137 2-(3-フルオロフェノキシ)-3-

[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-88)

実施例136で得られた2-(3-フルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 410mgが得られた。

1) 融点 136.5-138℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0529】 3.00-3.20 (2H, m), 3.56-3.70 (2H, m), 4.01-4.12 (2H, m), 4.90-5.00 (1H, m), 6.62-6.80 (3H, m), 6.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.16-7.31 (3H, m), 7.37-7.43 (1H, m), 7.85-8.08 (4H, m), 8.19 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.70 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 8.71-8.82 (1H, m)。

実施例138 2-(3,5-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-168のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 400mg、3,5-ジフルオロフェノール 240mg、トリフェニルホスフィン 483mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.60mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 460mgが得られた。

1) 融点 146-147℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0530】 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.18 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.89 (2H, d, $J=5.0$ Hz), 4.16 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.19 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.68 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.31-6.45 (3H, m), 6.66 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.26-7.31 (1H, m), 7.75-7.80 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例139 2-(3,5-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-168)

実施例138で得られた2-(3,5-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 410mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 350mgが得られた。

1) 融点 149.5-151℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

10 重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0531】 3.05-3.25 (2H, m), 3.65 (2H, d, $J=5.5$ Hz), 4.11 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 5.08 (1H, t, $J=5.5$ Hz), 6.65 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 6.70-6.83 (1H, m), 6.91 (2H, d, $J=7.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=7.5$ Hz), 7.38-7.45 (1H, m), 7.90-8.10 (4H, m), 8.18 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.70 (1H, d, $J=4.5$ Hz), 8.79 (1H, t, $J=5.0$ Hz)。

20 実施例140 2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-152のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 312mg、3,4-ジフルオロフェノール 187mg、トリフェニルホスフィン 377mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.65mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 213mgが得られた。

1) 融点 133-134℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0532】 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.17 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.90 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.16 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.64 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.48-6.60 (1H, m), 6.62-6.84 (2H, m), 6.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.00 (1H, q, $J=9.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.26-7.31 (1H, m), 7.72-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例141 2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-152)

実施例140で得られた2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベ

(266)

529

ンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 281mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 1.02ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 246mg が得られた。

1) 融点 135-136℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0533】 3.20 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.80 (2H, q, $J=5.5$ Hz), 4.23 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.73 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.56-6.66 (1H, m), 6.68-6.77 (2H, m), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.00 (1H, q, $J=9.5$ Hz), 7.19 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.36 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 7.74 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.84-7.87 (1H, m), 7.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.71 (1H, d, $J=4.5$ Hz)。

実施例142 2-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-184のエチルエステル) 参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 385mg、3, 4, 5-トリフルオロフェノール 262mg、トリフェニルホスフィン 465mg および40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.58ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 415mg が得られた。

1) 融点 150-152℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0534】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.16 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.90 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.16 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.19 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.62 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.41-6.50 (2H, m), 6.66 (1H, t, $J=5.0$ Hz), 6.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.73-7.81 (2H, m), 7.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例143 2-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-184)

実施例142で得られた2-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオ

530

ン酸エチル 380mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 320mg が得られた。1) 融点 144-146℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0535】 3.16-3.23 (2H, m), 3.80-3.90 (2H, m), 4.17-4.25 (2H, m), 4.66 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 6.41-6.58 (2H, m), 6.75-6.82 (1H, m), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.38 (1H, t, $J=6.0$ Hz), 7.70-7.90 (6H, m), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例144 2-ペンタフルオロフェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号138-200のエチルエステル)

参考例39で得られた2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 500mg、ペンタフルオロフェノール 424mg、トリフェニルホスフィン 604mg および40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 1.10ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 (若干の不純物を含む) 918mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0536】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.12-3.33 (2H, m), 3.82-3.94 (2H, m), 4.10-4.27 (4H, m), 4.91 (1H, dd, $J=5.0, 7.5$ Hz), 6.62-6.72 (1H, m), 6.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.18-7.30 (3H, m), 7.70-7.80 (2H, m), 7.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.72 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

実施例145 2-ペンタフルオロフェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-200)

実施例144で得られた2-ペンタフルオロフェノキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 910mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 240mg が得られた。

1) 融点 145-146℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル

(267)

531

(270 MHz) は次の通りである。

【0537】 3.19-3.41 (2H, m), 3.75-4.10 (2H, m), 4.21-4.32 (2H, m), 5.04 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.70-6.85 (1H, m), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.26 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.38-7.46 (1H, m), 7.68-7.81 (3H, m), 7.81-7.98 (3H, m), 8.77 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例146 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-51のメチルエステル)

参考例44で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸メチル 314 mg、ビフェニル-4-カルボン酸 158 mg、シアノリン酸ジエチル 0.12 ml およびトリエチルアミン 0.30 ml を用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、白色粉末の目的化合物 276 mg が得られた。

1) 融点 105-106°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0538】 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.72 (3H, s), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.68 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.63 (1H, brt), 6.76 (2H, dd, J=4.0, 9.0 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, t, J=9.0 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.41 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.44 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.47 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.61 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.66 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例147 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号138-51) 実施例146で得られた3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸メチル 266 mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 1.04 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 241 mg が得られた。

1) 融点 162-163°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム: 重メタノール (10:1) の混合溶液中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0539】 3.19 (1H, d, J=7.5 Hz), 3.20 (1H, d, J=5.0 Hz), 3.87 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.66 (1H, dd, J=5.0, 7.5 Hz), 6.78 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, t, J=9.0 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.38 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.43 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.46 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.60 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

532

d, J=4.5, 9.0 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, t, J=9.0 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.38 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.43 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.46 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.60 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.0 Hz), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

実施例148 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[6-(4-メトキシフェニル)ピリジン-3-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル (例示化合物番号34-40のエチルエステル)

参考例45で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 400 mg、参考例26で得られた6-(4-メトキシフェニル)ニコチン酸 208 mg、シアノリン酸ジエチル 0.14 ml およびトリエチルアミン 0.23 ml を用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 355 mg が得られた。

1) 融点 92-94°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0540】 1.01-1.28 (9H, m), 1.36 (3H, s), 2.76-2.91 (1H, m), 3.10 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.26 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.87 (3H, s), 3.81-3.94 (2H, m), 4.10-4.27 (4H, m), 6.60-6.68 (1H, m), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.01 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.74 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.01 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.13 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 9.01 (1H, d, J=2.0 Hz)。

実施例149 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-メチルプロピオン酸 (例示化合物番号34-40)

実施例148で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[2-(4-メトキシフェニル)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル 341 mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 1.14 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 144 mg が得られた。

1) 融点 194-196°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0541】 1.15 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.27 (3H, s),

(268)

533

2.72-2.89 (1H, m), 3.06 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.17 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.61-3.70 (2H, m), 3.83 (3H, s), 4.08-4.16 (2H, m), 6.74 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.17 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.01 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.24 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 8.86-8.94 (1H, m), 9.05 (1H, d, J=2.0 Hz)。

実施例150 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

(例示化合物番号34-43のエチルエステル)

参考例45で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

600mg、参考例28で得られた6-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ニコチン酸 344mg、シアノリン酸ジエチル 0.21mlおよびトリエチルアミン 0.38mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 260mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400MHz) は次の通りである。

【0542】1.16-1.28 (9H, m), 1.37 (3H, s), 2.83 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.11 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.26 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.83-3.89 (2H, m), 4.10-4.18 (2H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.75 (2H, t, J=12.5 Hz), 6.00 (1H, tt, J=4.5, 53 Hz), 6.53-6.60 (1H, m), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.81-6.90 (3H, m), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.59 (1H, s)。

実施例151 3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸 (例示化合物番号34-43)

実施例150で得られた3-[4-[2-[2-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ピリジン-5-カルボニルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 210mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.51mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 140mg が得られた。

1) 融点 173-175℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム-重メタノール (20:1) の混合溶液

534

中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400MHz) は次の通りである。

【0543】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.40 (3H, s), 2.84 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.13 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.26 (1H, d, J=14.0 Hz), 3.80-3.89 (2H, m), 4.14-4.20 (2H, m), 4.78 (2H, t, J=12.5 Hz), 6.00 (1H, tt, J=4.5, 53 Hz), 6.80-6.92 (5H, m), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.55 (1H, s)。

実施例152 2-フェニルチオ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号17-11のメチルエステル)

参考例46で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェニルチオプロピオン酸メチル 209mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 135mgおよびトリエチルアミン 0.27mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 146mg が得られた。

1) 融点 102-104℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0544】3.00 (1H, dd, J=6.0, 13.5 Hz), 3.14 (1H, dd, J=9.0, 13.5 Hz), 3.58 (3H, s), 3.86 (1H, dd, J=6.0, 9.0 Hz), 3.90 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 6.65 (1H, brt), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.16-7.37 (4H, m), 7.38-7.48 (2H, m), 7.71-7.81 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例153 2-フェニルチオ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号17-11)

実施例152で得られた2-フェニルチオ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 150mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.58mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 138mg が得られた。

1) 融点 75-77℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0545】3.00 (1H, dd, J=5.0, 13.5 Hz), 3.11

(269)

535

(1H, dd, J=10.5, 13.5 Hz), 3.82 (2H, t, J=5.0 Hz), 3.87 (1H, dd, J=5.0, 10.5 Hz), 4.24 (1H, dd, J=5.0, 9.5 Hz), 4.33 (1H, dd, J=5.0, 9.5 Hz), 6.53 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.27-7.38 (4H, m), 7.51-7.54 (2H, m), 7.61 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.82-7.89 (1H, m), 7.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.63 (1H, d, J=5.0 Hz).

実施例154 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(3-ピリジルオキシ)プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-216のメチルエステル)

参考例47で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(3-ピリジルオキシ)プロピオン酸メチル 345mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 261mgおよびトリエチルアミン 0.60mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 271mgが得られた。

1) 融点 101-103℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0546】3.22 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.73 (3H, s), 3.90 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.78 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.66 (1H, brt), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09-7.18 (2H, m), 7.22 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.26-7.33 (1H, m), 7.73-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.16-8.26 (2H, m), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例155 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(3-ピリジルオキシ)プロピオン酸 (例示化合物番号138-216)

実施例154で得られた3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-(3-ピリジルオキシ)プロピオン酸メチル 248mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 212mgが得られた。

1) 融点 194-196℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0547】3.10 (1H, dd, J=8.5, 14.5 Hz), 3.18 (1H, dd, J=4.0, 14.5 Hz), 3.64 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.5 Hz), 5.04 (1H, dd, J=4.0, 8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.26 (1H, dd, J=6.5, 8.0 Hz), 7.27 (1H, d, J=6.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 8.0 Hz), 7.92 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.14 (1H, s), 8.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz), 8.79 (1H, brt)。

536

z), 7.26 (1H, dd, J=6.5, 8.0 Hz), 7.27 (1H, d, J=6.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 8.0 Hz), 7.92 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.14 (1H, s), 8.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz), 8.79 (1H, brt)。

実施例156 2-(ベンズオキサゾール-2-イルチオ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-248のメチルエステル)

参考例48で得られた2-(ベンズオキサゾール-2-イルチオ)-3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸メチル 665mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 444mgおよびトリエチルアミン 0.81mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、フォーム状固体の目的化合物 582mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

20 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0548】3.30 (1H, dd, J=7.5, 15.0 Hz), 3.35 (1H, dd, J=7.5, 15.0 Hz), 3.71 (3H, s), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.13 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.77 (1H, t, J=7.5 Hz), 6.68 (1H, brt), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24-7.38 (3H, m), 7.42 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.60 (1H, d, J=6.0 Hz), 7.75-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例157 2-(ベンズオキサゾール-2-イルチオ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-248)

実施例156で得られた2-(ベンズオキサゾール-2-イルチオ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 361mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.30mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 248mgが得られた。

1) 融点 66-67℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0549】3.20-3.36 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.10 (1H, t, J=5.5 Hz), 4.19 (1H, t, J=5.5 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.89 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.26 (1H, dd, J=6.5, 8.0 Hz), 7.27 (1H, d, J=6.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 8.0 Hz), 7.92 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.14 (1H, s), 8.18 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.18 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz), 8.79 (1H, brt)。

(270)

537

z), 7.28 (1H, t, J=4.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 8.5 Hz), 7.48 (1H, dd, J=4.0, 5.0 Hz), 7.54 (1H, d, J=4.0, 5.0 Hz), 7.92 (2H, d, J=4.0 Hz), 7.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.64 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例158 2-ベンジルオキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号138-232のメチルエステル)

参考例49で得られた2-ベンジルオキシ-3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸メチル 195mg 4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 127mg およびトリエチルアミン 0.25mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 106mg が得られた。

1) 融点 122-123℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0550】3.00 (1H, d, J=7.5 Hz), 3.01 (1H, d, J=5.5 Hz), 3.71 (3H, s), 3.91 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.10 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 4.17 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.37 (1H, d, J=12.0 Hz), 4.66 (1H, d, J=12.0 Hz), 6.68 (1H, brt), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.22-7.37 (4H, m), 7.76-7.83 (2H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例159 2-ベンジルオキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号138-232)

実施例158で得られた2-ベンジルオキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 94mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 0.36mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 86mg が得られた。

1) 融点 138-139℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0551】3.01 (1H, dd, J=7.0, 14.5 Hz), 3.12 (1H, dd, J=5.0, 14.5 Hz), 3.90 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.18 (1H, dd, J=5.0, 7.0 Hz), 4.20 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.48 (1H, d, J=11.5 Hz), 4.67 (1H, d, J=11.5 Hz), 6.69 (1H, brt), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.16

538

(2H, d, J=8.5 Hz), 7.22-7.43 (6H, m), 7.75 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.79 (1H, dd, J=8.0, 9.0 Hz), 7.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例160 2-(3-フェニルプロピル)-2-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号77-3) 参考例50で得られた2-(3-フェニルプロピル)-2-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジル]マロン酸ジベンジル 0.65g をエタノール 20ml に溶解し、5%パラジウム-炭素 0.12g を加え、水素雰囲気下、60℃で5時間攪拌した。触媒を濾去し、濾液を濃縮した後、残留物を2-メトキシエタノール 10ml に溶かし、溶液を150℃で4時間攪拌した。反応液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=9:1) に付して精製すると、結晶性の目的化合物 330mg が得られた。

1) 融点 118-119℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0552】1.75-1.82 (4H, m), 1.99 (2H, quintuplet, J=7.5 Hz), 2.58-2.77 (6H, m), 2.96 (1H, dd, J=11.0, 15.0 Hz), 3.51 (2H, dt, J=5.5, 7.5 Hz), 6.16 (1H, brt, J=5.5 Hz), 7.12-7.18 (6H, m), 7.23-7.33 (4H, m), 7.60 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, dd, J=1.0, 8.0 Hz), 7.80 (1H, dd, J=2.0, 8.0 Hz), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.65-8.67 (1H, m)。

実施例161 3-[3-クロロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号139-24のエチルエステル)

参考例51で得られた3-[4-(2-t-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)-3-クロロフェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 738mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 445mg およびトリエチルアミン 0.89mlを用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、フォーム状固体の目的化合物 677mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0553】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.16 (1H, d, J=5.5 Hz), 3.17 (1H, d, J=7.0 Hz), 3.93 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.22 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.73 (1H, dd, J=5.5, 7.0 Hz), 6.83 (2H, d,

(271)

539

J=8.5 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.95 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.18 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 7.24 (2H, t, J=8.0 Hz), 7.26-7.33 (1H, m), 7.35 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.77-7.85 (2H, m), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例 162 3-[3-クロロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号 139-24)

実施例 161 で得られた 3-[3-クロロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 540 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 1.98 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 404 mg が得られた。

1) 融点 59-61°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0554】3.19 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.83-3.98 (2H, m), 4.23 (2H, brt), 4.79 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.86 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (1H, t, J=8.0 Hz), 7.12 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 7.23 (2H, t, J=8.0 Hz), 7.33 (1H, dd, J=4.5, 7.5 Hz), 7.36 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.72 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.84 (1H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例 163 3-[3-ブロモ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号 141-23 のエチルエステル)

参考例 52 で得られた 3-[3-ブロモ-4-(2-トキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸メチル 466 mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 254 mg およびトリエチルアミン 0.51 ml を用いて、実施例 126 に準じて反応および後処理を行い、フォーム状固体の目的化合物 498 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0555】1.21 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.16 (1H, d, J=5.5 Hz), 3.17 (1H, d, J=7.0 Hz), 3.94 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.22 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.73 (1H, dd, J=5.5, 7.0 Hz), 6.82-6.98 (1H, m), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.95 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.21-7.32 (1H, m), 7.2

540

4 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.25 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.76-7.80 (2H, m), 7.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例 164 3-[3-ブロモ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号 141-23)

実施例 163 で得られた 3-[3-ブロモ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 237 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 0.80 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 174 mg が得られた。

1) 融点 83-84°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重メタノール中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0556】3.12 (1H, dd, J=7.5, 14.0 Hz), 3.20 (1H, dd, J=5.0, 14.0 Hz), 3.81 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.24 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.86 (1H, dd, J=5.0, 7.5 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.91 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.02 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.17 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.22 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.26 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 8.0 Hz), 7.52 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.93 (1H, t, J=4.5 Hz), 7.95 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.64 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例 165 3-[3-ニトロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル (例示化合物番号 142-23 のエチルエステル)

参考例 53 で得られた 3-[3-ニトロ-4-(2-トキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 723 mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 465 mg およびトリエチルアミン 0.85 ml を用いて、実施例 126 に準じて反応および後処理を行い、フォーム状固体の目的化合物 843 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0557】1.22 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.24 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.96 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.31 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.76 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.96 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.05 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (1H, brt), 7.22-7.30 (1H, m), 7.24 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.53

(272)

541

(1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 7.75-7.80 (2H, m), 7.88 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.97 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例166 3-[3-ニトロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸 (例示化合物番号142-23)

実施例165で得られた3-[3-ニトロ-4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 223 mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.80 mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 137 mgが得られた。

1) 融点 178-179℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム: 重メタノール (1:9) の混合溶液中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0558】 3.22 (1H, dd, J=8.0, 14.5 Hz), 3.26 (1H, dd, J=5.0, 14.5 Hz), 3.84 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.36 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.83 (1H, dd, J=5.0, 8.0 Hz), 6.85 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.92 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.23 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.24 (1H, d, J=6.5 Hz), 7.40 (1H, dd, J=4.5, 6.5 Hz), 7.58 (1H, d, J=2.0, 8.5 Hz), 7.84 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.91 (1H, t, J=8.5 Hz), 7.92 (1H, t, J=4.5 Hz), 7.96 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.03 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.65 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例167 (S)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号144-63のメチルエステル)

参考例54で得られた(S)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸メチル 368 mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 175 mg、シアノリン酸ジエチル 0.13 mlおよびトリエチルアミン 0.22 mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 300 mgが得られた。

1) 融点 150-151℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0559】 2.90-3.12 (2H, m), 3.72 (3H, s), 3.82-3.94 (2H, m), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.55-4.69 (1H, m), 5.09 (2H, ABq, J=12.5 Hz, Δ=0.03 ppm), 5.21 (1H, d, J=8.0 Hz), 6.61-6.72 (1H, m), 6.83 (2

542

H, d, J=8.5 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22-7.41 (6H, m), 7.72-7.82 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例168 (S)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号144-63)

実施例167で得られた(S)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 200 mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.72 mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、フォーム状の目的化合物 144 mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0560】 3.08 (2H, d, J=5.0 Hz), 3.68-4.00 (2H, m), 4.08-4.30 (2H, m), 4.55-4.69 (1H, m), 5.11 (2H, s), 5.37 (1H, d, J=8.0 Hz), 6.70-6.90 (3H, m), 6.99 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20-7.41 (6H, m), 7.70-7.93 (6H, m), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz)。

実施例169 (S)-2-プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル (例示化合物番号144-13のメチルエステル)

実施例167で得られた(S)-2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 1.53 gおよび5%パラジウム-炭素 150 mgを用いて、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の(S)-2-アミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 1.14 gが得られた。このようにして得られたアミン 1.12 gをN,N-ジメチルホルムアミド 10 mlに溶解し、臭化プロピル 0.24 mlおよび炭酸カリウム 387 mgを加え、70℃にて16時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン: メタノール=19:1) にて精製し、無色結晶の目的化合物 196 mgが得られた。

1) 融点 86-87℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

(273)

543

【0561】0.86 (3H, t, J=7.5 Hz), 1.39-1.59 (2H, m), 2.39-2.60 (2H, m), 2.90 (2H, d, J=7.0 Hz), 3.48 (1H, t, J=7.0 Hz), 3.64 (3H, s), 3.87-3.95 (2H, m), 4.10-4.20 (2H, m), 6.60-6.71 (1H, m), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.78-7.80 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5.0 Hz)。

実施例170 (S)-2-プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号144-13)

実施例169で得られた(S)-2-プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸メチル 169mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 0.73mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 144mgが得られた。

1) 融点 242-244℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

(S)-2-プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩として 重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0562】0.76 (3H, t, J=7.5 Hz), 1.15-1.35 (2H, m), 1.60-1.72 (1H, m), 2.04-2.21 (1H, m), 2.31-2.50 (1H, m), 2.70-2.81 (2H, m), 3.30-3.41 (1H, m), 3.58-3.72 (2H, m), 4.00-4.12 (2H, m), 6.80 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.37-7.45 (1H, m), 7.88-8.11 (4H, m), 8.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.5 Hz), 8.80-8.88 (1H, m)。

実施例171 2-フェニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル (例示化合物番号144-68のエチルエステル)

参考例61で得られた2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エタノールと参考例55(b)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(フェニルアミノ)プロピオン酸エチルとを実施例122と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例172 2-フェニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号144-68)

実施例171で得られる2-フェニルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチルをメタノール

544

中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例173 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェニルアミノプロピオン酸エチル (例示化合物番号144-67のエチルエステル)

2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エタノールと参考例55(b)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(フェニルアミノ)プロピオン酸エチルを実施例122と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例174 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェニルアミノプロピオン酸 (例示化合物番号144-67)

実施例173で得られる3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェニルアミノプロピオン酸エチルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例175 2-エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号144-8のエチルエステル)

(a) 2-(N-tert-ブトキシカルボニル)エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例61で得られた2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エタノールと参考例59(b)で得られた2-(N-tert-ブトキシカルボニル)エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチルとを実施例122と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

(b) 2-エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号144-8のエチルエステル)

実施例175(a)で得られる2-(N-tert-ブトキシカルボニル)エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチルを4N塩化水素・ジオキサン溶液で処理して目的化合物の塩酸塩を得る。

実施例176 2-エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 (例示化合物番号144-8)

実施例175(b)で得られる2-エチルアミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル・塩酸塩をメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。実施例177 3-[4-[2-(ビフ

(274)

545

エニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]
-2-エチルアミノプロピオン酸エチル・塩酸塩 (例
 示化合物番号 1 4 4-7 のエチルエステル)

(a) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニル
アミノ) エトキシ] フェニル] -2-(N-tert-ブトキ
シカルボニル) エチルアミノプロピオン酸エチル 2-

(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エタノールと参
 考例 5 9 (b) で得られた 2-(N-tert-ブトキシカル
 ボニル) エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニ
 ル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリ
 フェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用い
 て縮合反応させ、目的化合物を得る。

(b) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニル
アミノ) エトキシ] フェニル] -2-エチルアミノプロ
ピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号 1 4 4-7 の
 エチルエステル)

実施例 1 7 7 (a) で得られる 3-[4-[2-(ビフ
 エニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]
 -2-(N-tert-ブトキシカルボニル) エチルアミノプロ
 ピオン酸エチルを 4 N 塩化水素・ジオキサン溶液で処
 理して目的化合物の塩酸塩を得る。

実施例 1 7 8 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カ
ルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-エチルア
ミノプロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-7)

実施例 1 7 7 (b) で得られる 3-[4-[2-(ビフ
 エニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル]
 -2-エチルアミノプロピオン酸エチル・塩酸塩をメタ
 ノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物
 を得る。

実施例 1 7 9 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)
-3-[4-[2-(2-ピリジル) ベンゾイル
アミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例
 示化合物番号 1 4 4-3 3 のエチルエステル)

参考例 6 1 で得られた 2-[4-(2-ピリジル) ベン
 ゾイルアミノ] エタノールと参考例 5 6 (b) で得られ
 た 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)-3-(4-
 ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチルとを実施例 1
 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン
 酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 8 0 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)
-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイル
アミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸 (例示化
 合物番号 1 4 4-3 3)

実施例 1 7 9 で得られる 2-(N-エチル-N-フェニル
 アミノ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベン
 ゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エ
 チルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して
 目的化合物を得る。

実施例 1 8 1 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カル
ボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-(N-エチ

546

ル-N-フェニルアミノ) プロピオン酸エチル (例示化
 合物番号 1 4 4-3 2 のエチルエステル)

2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エタノール
 と参考例 5 6 (b) で得られた 2-(N-エチル-N-フ
 エニルアミノ)-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロ
 ピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニル
 ホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反
 応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 8 2 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カル
ボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-(N-エチ
ル-N-フェニルアミノ) プロピオン酸 (例示化合物番
 号 1 4 4-3 2)

実施例 1 8 1 で得られる 3-[4-[2-(ビフェニル-
 4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] -2-
 (N-エチル-N-フェニルアミノ) プロピオン酸エチル
 をメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的
 化合物を得る。

実施例 1 8 3 2-プロピルアミノ-3-[4-[2-
[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ]
フェニル] プロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番
 号 1 4 4-1 3 のエチルエステル)

(a) 2-(N-tert-ブトキシカルボニル) プロピルア
ミノ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾ
イルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル
 参考例 6 1 で得られた 2-[4-(2-ピリジル) ベン
 ゾイルアミノ] エタノールと参考例 6 0 (b) で得られ
 た 2-(N-tert-ブトキシカルボニル) プロピルアミノ
 -3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル
 とを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとア
 ザジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化
 合物を得る。

(b) 2-プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-
(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニ
ル] プロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号 1 4
 4-1 3 のエチルエステル)

実施例 1 8 3 (a) で得られる 2-(N-tert-ブトキシ
 カルボニル) プロピルアミノ-3-[4-[2-[4-
 (2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニ
 ル] プロピオン酸エチルを 4 N 塩化水素・ジオキサン溶
 液で処理して目的化合物の塩酸塩を得る。

実施例 1 8 4 2-プロピルアミノ-3-[4-[2-
[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ]
フェニル] プロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-1
 3)

実施例 1 8 3 (b) で得られる 2-プロピルアミノ-3-
 [4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミ
 ノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル・塩酸塩
 をメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的
 化合物を得る。

実施例 1 8 5 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カル

(275)

547

ボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-プロピルアミノプロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号 1 4 4-1 2 のエチルエステル)

(a) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-(N-t-ブトキシカルボニル) プロピルアミノプロピオン酸エチル 2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エタノールと参考例 6 0 (b) で得られた 2-(N-t-ブトキシカルボニル) プロピルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

(b) 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-プロピルアミノプロピオン酸エチル・塩酸塩 (例示化合物番号 1 4 4-1 2 のエチルエステル)

実施例 1 8 5 (a) で得られる 2-(N-t-ブトキシカルボニル) プロピルアミノ-3-[4-[2-(4-フェニルベンゾイルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチルを 4 N 塩化水素・ジオキサン溶液で処理して目的化合物の塩酸塩を得る。

実施例 1 8 6 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-プロピルアミノプロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-1 2)

実施例 1 8 5 (b) で得られる 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-プロピルアミノプロピオン酸エチル・塩酸塩をメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例 1 8 7 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル (例示化合物番号 1 4 4-2 8 のエチルエステル)

参考例 6 1 で得られた 2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エタノールと参考例 5 8 で得られた 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 8 8 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-2 8)

実施例 1 8 7 で得られる 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例 1 8 9 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-(N, N-ジ

548

エチルアミノ) プロピオン酸エチル (例示化合物番号 1 4 4-2 7 のエチルエステル)

2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エタノールと参考例 5 8 で得られた 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 9 0 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-(N, N-ジエチルアミノ) プロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-2 7)

実施例 1 8 9 で得られる 2-(N, N-ジエチルアミノ) - 3-[4-[2-(4-フェニルベンゾイルアミノ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例 1 9 1 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸エチル (例示化合物番号 1 4 4-3 8 のエチルエステル)

参考例 6 1 で得られた 2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エタノールと参考例 5 7 (b) で得られた 3-(4-ヒドロキシフェニル) - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 9 2 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-3 8)

実施例 1 9 1 で得られる 3-[4-[2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エトキシ] フェニル] - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸エチルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

実施例 1 9 3 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸エチル (例示化合物番号 1 4 4-3 7 のエチルエステル)

2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エタノールと参考例 5 7 (b) で得られた 3-(4-ヒドロキシフェニル) - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸エチルとを実施例 1 2 2 と同様にトリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチルを用いて縮合反応させ、目的化合物を得る。

実施例 1 9 4 3-[4-[2-(ビフェニル-4-カルボニルアミノ) エトキシ] フェニル] - 2-(ピロル-1-イル) プロピオン酸 (例示化合物番号 1 4 4-3 7)

実施例193で得られる3-[4-(2-(4-フェニルベンゾイルアミノ)エトキシ)フェニル]-2-(ピロリル-1-イル)プロピオン酸エチルをメタノール中、水酸化ナトリウムで加水分解して目的化合物を得る。

【0563】

【参考例】参考例1 2-エトキシ-3-[4-(2-フタルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル
(a) N-[2-(メタンスルホニルオキシ)エチル]フタルイミド

N-(2-ヒドロキシエチル)フタルイミド 19.1 gを無水ジクロロメタン 200 mlに溶解し、この溶液にメタンスルホンクロライド 12.7 gを加えた後、氷冷下でトリエチルアミン 20 mlを滴下した。反応液を室温で4時間攪拌後、反応液を減圧下で濃縮し、得られた固体を酢酸エチルおよび水で洗浄した。次いで、酢酸エチルで再結晶すると、目的化合物 18.2 gが得られた。

1) 融点 138-139°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0564】 3.02 (3H, s), 4.05 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.49 (2H, t, J=5.5 Hz), 7.70-7.80 (2H, m), 7.83-7.93 (2H, m)。

(b) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル
3-(4-ヒドロキシフェニル)乳酸エチル 22.4 gをジメチルホルムアミド 220 mlに溶解した溶液に、ベンジルブロマイド 21.9 gおよび炭酸カリウム 35.3 gを加え、50°Cで2時間攪拌した。この反応液に酢酸エチルと水を加え攪拌し、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=7:3) に付して精製すると、淡黄色油状の目的化合物 31.0 gが得られた。

(c) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-エトキシプロピオン酸エチル

参考例1 (b) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル 10.30 gをN、N-ジメチルアセトアミド 50 mlおよびトルエン 50 mlの混合溶媒に溶解し、室温で5%油状水素化ナトリウム

1.65 gを加え、40°Cで30分間攪拌した。この反応溶液にヨウ化エチル 3.3 mlおよびトルエン 5 mlを滴下し、40°Cで更に2時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下で留去後、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=5:1) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 5.50

gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0565】 1.11-1.26 (6H, m), 2.95 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.36 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.60 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.97 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.15 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.05 (2H, s), 6.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.16 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.30-7.48 (5H, m)。

(d) 2-エトキシ-3-ヒドロキシフェニルプロピオン酸エチル

参考例1 (c) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-エトキシプロピオン酸エチル 5.50 gをエタノール 60 mlに溶解し、この溶液に5%パラジウム-炭素 0.70 gを加え、水素雰囲気下で40°Cで2時間攪拌した。反応終了後、触媒をろ過し、反応液を減圧下で濃縮した。得られた残留物を酢酸エチルと水に溶解後、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下で濃縮すると、シロップ状の目的化合物 3.80 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0566】 1.12-1.28 (6H, m), 2.95 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.37 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.60 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.99 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.38 (1H, s), 6.73 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.48 (5H, m)。

(e) 2-エトキシ-3-[4-(2-フタルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例1 (d) で得られた2-エトキシ-3-ヒドロキシフェニルプロピオン酸エチル 1.00 gをジメチルアセトアミド 10 mlとトルエン 10 mlの混合溶液に溶解し、この溶液に5%油状水素化ナトリウム 200 mgを加え、室温で20分間攪拌した。この反応溶液中に参考例1 (a) で得られたN-[2-(メタンスルホニルオキシ)エチル]フタルイミド 1.50 gを加え、70°Cで2.5時間、60°Cで24時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下で留去後、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ベンゼン: 酢酸エチル=8:1) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 0.31 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル

(277)

551

(270MHz) は次の通りである。

【0567】1.09-1.28 (6H, m), 2.92 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.37 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.58 (1H, quintuplet, J=7.0 Hz), 3.93 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.06-4.25 (6H, m), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.68-7.91 (4H, m)。

参考例2 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-(2-フタルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

(a) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-(3-フェニルプロピル)マロン酸ジエチル 2-(3-フェニルプロピル)マロン酸ジエチル 2.78g をトルエン 20ml およびN、N-ジメチルアセトアミド 10ml の混合溶液に溶解し、この溶液に5%油性水素化ナトリウム 0.48g を加え、室温で30分間攪拌した。次いで、これに4-ベンジルオキシベンジルクロライド 2.45g を加え、室温で30分間、次いで60℃で30分間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え、次いで酢酸エチル層を分離した。酢酸エチルを無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=9:1)に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 3.91g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0568】1.21 (6H, t, J=7.0 Hz), 1.57-1.66 (2H, m), 1.76-1.85 (2H, m), 2.61 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.14 (2H, s), 4.15 (4H, dq, J=1.5, 7.0 Hz), 5.01 (2H, s), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15-7.44 (10H, m)。

(b) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-5-フェニル吉草酸エチル

参考例2 (a) で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-(3-フェニルプロピル)マロン酸ジエチル 3.91g を2-メトキシエタノール30ml および水 3ml の混合溶液に溶解し、この溶液に水酸化カリウム 2.00g を加え、130℃の油浴上で1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液を濃縮し、濃縮液に水と酢酸エチルを加え、次いで6N塩酸を加えて酸性にした。次いで酢酸エチル層を分離し、食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。得られた残留シロップをキシレン 20ml に溶解し1時間攪拌した後、濃縮した。得られたシロップ状の2-(4-ベンジルオキシベンジル)-5-フェニル吉草酸をエタノール 40ml に溶解し、濃硫酸 1ml を加え、80℃で3時間攪拌した後、室温で16時間放置した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物を酢酸エチル

552

と水に溶解し、次いで酢酸エチル層を分離した。酢酸エチルを無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮するとシロップ状の目的化合物 3.32g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0569】1.13 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.50-1.80 (4H, m), 2.53-2.71 (4H, m), 2.82-2.90 (1H, m), 4.04 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.04 (2H, s), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.44 (10H, m)。

(c) 2-(4-ヒドロキシベンジル)-5-フェニル吉草酸エチル

参考例2 (b) で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)-5-フェニル吉草酸エチル 3.32g と5%パラジウム-炭素 0.40g を用い、参考例1

(d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2.56g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0570】1.14 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.50-1.75 (4H, m), 2.53-2.71 (4H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 6.70 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.12-7.29 (5H, m)。

(d) 2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-(2-フタルイミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例2 (c) で得られた2-(4-ヒドロキシベンジル)-5-フェニル吉草酸エチル 1.42g、5%油性水素化ナトリウム 228mg および参考例1

(a) で得られたN-[2-(メタンスルホニルオキシ)エチル]フタルイミド 1.25g を用い、参考例1 (e) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.34g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0571】1.12 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.46-1.70 (4H, m), 2.50-2.70 (4H, m), 2.76-2.89 (1H, m), 4.02 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.5 Hz), 6.77 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.20 (3H, m), 7.21-7.29 (2H, m), 7.69-7.76 (2H, m), 7.82-7.89 (2H, m)。

参考例3 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(2-フェノキシエチル)プロピオン酸エチル

(278)

553

(a) 2-(4-メトキシメトキシベンジリデン) マロン酸ジエチル

4-メトキシメトキシベンズアルデヒド 16.2 g をエタノール 160 ml に溶解し、この溶液中にピペリジン 1.5 ml およびマロン酸ジエチル 14.9 ml を加え、還流下で7時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルを加え、次いで酢酸エチル層を、0.8 N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水および飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=9：1～3：1）に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 5.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0572】1.33 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 3.48 (3H, s), 4.29 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.36 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.20 (2H, s), 7.03 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 7.42 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 7.67 (1H, s)。

(b) 2-(4-メトキシメトキシベンジル) マロン酸ジエチル

参考例3 (a) で得られた2-(4-メトキシメトキシベンジリデン) マロン酸ジエチル 4.98 g と5%パラジウム-炭素 0.50 g を用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 5.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0573】1.24 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 3.18 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 3.49 (3H, s), 3.62 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 4.18 (4H, q, $J=7.0$ Hz), 5.17 (2H, s), 6.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.15 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 2-(4-メトキシメトキシベンジル) - 2-(2-フェノキシエチル) マロン酸ジエチル

参考例3 (b) で得られた2-(4-メトキシメトキシベンジル) マロン酸ジエチル 1.58 g、55%油状水素化ナトリウム 0.24 g および2-フェノキシエチルプロマイド 1.23 g を用い、参考例2 (a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.72 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0574】1.22 (6H, t, $J=7.5$ Hz), 2.30 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 3.30 (2H, s), 3.47 (3H, s), 4.08 (2H,

554

t, $J=6.5$ Hz), 4.19 (4H, q, $J=7.5$ Hz), 5.14 (2H, s), 6.84-6.96 (5H, m), 7.05 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 7.16-7.30 (2H, m)。

(d) 2-(4-ヒドロキシベンジル) - 4-フェノキシブチル酸エチル

参考例3 (c) で得られた2-(4-メトキシメトキシベンジル) - 2-(2-フェノキシエチル) マロン酸ジエチル 1.71 g および水酸化カリウム 1.31 g を用い、参考例2 (b) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.25 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0575】1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.90-2.20 (2H, m), 2.74-2.98 (3H, m), 3.90-4.14 (4H, m), 4.71 (1H, s), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.05 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22-7.30 (2H, m)。

(e) 2-(2-フェノキシエチル) - 3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル

参考例3 (d) で得られた2-(4-ヒドロキシベンジル) - 4-フェノキシブチル酸エチル 620 mg を2-ブタノン 8 ml に溶解し、この溶液中に2-(2-ブロモエトキシ) テトラヒドロピラン 1.24 g および炭酸カリウム 1.09 g を加え、100℃で5時間攪拌した。この反応溶液中にジメチルアセトアミド 10 ml を加え、更に100℃で1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え、次いで酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4：1）に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 738 mg が得られた。1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0576】1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.50-2.10 (8H, m), 2.73-2.98 (3H, m), 3.48-3.58 (1H, m), 3.77-4.17 (9H, m), 4.71 (1H, t, $J=3.5$ Hz), 6.82-6.87 (4H, m), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23-7.29 (2H, m)。

(f) 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ) フェニル] - 2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル

参考例3 (e) で得られた2-(2-フェノキシエチル) - 3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イル

(279)

555

ルオキシ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 738mg をエタノール 10ml に溶解し、この溶液中に p-トルエンスルホン酸一水和物 0.40g を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水を加え、次いで酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=7:3~3:2) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 503mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0577】 1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.90-2.10 (3H, m), 2.75-3.00 (3H, m), 3.92-4.11 (8H, m), 6.82-6.87 (4H, m), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23-7.29 (2H, m)。

(g) 3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル

参考例 3 (f) で得られた 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル 503mg を無水ジクロロメタン 10ml に溶解し、この溶液中にトリエチルアミン 0.29ml とメタンスルホンクロライド 0.12ml を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加え、次いで酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=2:1~3:2) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 632mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0578】 1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.90-2.20 (2H, m), 2.75-3.00 (3H, m), 3.09 (3H, s), 3.89-4.02 (2H, m), 4.07 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.20-4.23 (2H, m), 4.54-4.58 (2H, m), 6.80-6.87 (4H, m), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23-7.30 (2H, m)。

(h) 3-[4-(2-アジドエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル
参考例 3 (g) で得られた 3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル 613mg をジメチルホルムアミド 8ml に溶解し、この溶液中にアジ化

556

ナトリウム 0.27g を加え、70℃で2時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え、次いで酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮すると、シロップ状の目的化合物 546mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0579】 1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.90-2.20 (2H, m), 2.75-3.00 (3H, m), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 3.89-4.14 (6H, m), 6.81-6.87 (4H, m), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22-7.30 (2H, m)。

(i) 3-[4-(2-アミノエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル

参考例 3 (h) で得られた 3-[4-(2-アジドエトキシ) フェニル]-2-(2-フェノキシエチル) プロピオン酸エチル 538mg と 5%パラジウム-炭素 50mg を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 476mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0580】 1.13 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.66 (2H, br s), 1.90-2.21 (2H, m), 2.75-3.07 (3H, m), 3.08 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 3.90-4.12 (6H, m), 6.82-6.88 (4H, m), 6.93 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23-7.30 (2H, m)。

参考例 4 3-[4-(2-アミノエトキシ) フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

(a) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-フェノキシマロン酸ジエチル
2-フェノキシマロン酸ジエチル 2.81g、4-ベンジルオキシベンジクロライド 2.59g および 5%油性水素化ナトリウム 530mg を用い、参考例 2 (a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3.10g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0581】 1.12 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 3.57 (2H, s), 4.15 (4H, q, $J=7.0$ Hz), 5.02 (2H, s), 6.84-7.14 (6H, m), 7.22-7.41 (8H, m)。

(b) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例 4 (a) で得られた 2-(4-ベンジルオキシベ

(280)

557

ンジル) - 2-フェノキシマロン酸ジエチル 3. 10 g および水酸化カリウム 2. 10 g を用い、参考例 2 (b) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の 3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸を経て、シロップ状の目的化合物 2. 10 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0582】 1.18 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.11-3.20 (2H, m), 4.16 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.74 (1H, dd, $J=5.5, 6.5$ Hz), 5.04 (2H, s), 6.84 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.92-6.97 (1H, m), 7.05-7.09 (1H, m), 7.22 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20-7.43 (6H, m)。

(c) 3- (4-ヒドロキシフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 参考例 4 (b) で得られた 3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 2. 10 g と 5%パラジウム-炭素 0. 32 g を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 01 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0583】 1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.10-3.24 (2H, m), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.74 (1H, dd, $J=6.0, 7.0$ Hz), 5.00 (1H, s), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.95 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.16 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.26 (2H, m)。

(d) 2-フェノキシ-3- [4- [2- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル

参考例 4 (c) で得られた 2-フェノキシ-3- (4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル 3. 33 g、2- (2-プロモエトキシ) テトラヒドロピラン 7. 27 g および炭酸カリウム 6. 41 g を用い、参考例 3 (e) に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 4. 53 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0584】 1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.50-1.88 (6H, m), 3.16-3.20 (2H, m), 3.48-3.56 (1H, m), 3.76-3.93 (2H, m), 4.00-4.21 (5H, m), 4.69-4.76 (2H, m), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz)

558

z), 6.94 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 7.18-7.26 (4H, m)。

(e) 3- [4- (2-ヒドロキシエトキシ) フェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例 4 (d) で得られた 2-フェノキシ-3- [4- [2- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 4. 53 g および p-トルエンスルホン酸-水和物 2. 70 g を用い、参考例 3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3. 28 g が得られた。

10 1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0585】 1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.98-2.02 (1H, brs), 3.14-3.20 (2H, m), 3.90-4.00 (2H, m), 4.06 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.74 (1H, dd, $J=6.0, 7.5$ Hz), 6.82-6.88 (4H, m), 6.95 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 7.21-7.26 (4H, m)。

(f) 3- [4- (2-メタンスルホニルオキシエトキシ) フェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 参考例 4 (e) で得られた 3- [4- (2-ヒドロキシエトキシ) フェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 3. 27 g、トリエチルアミン 2. 07 ml およびメタンスルホンクロライド 0. 84 ml を用い、参考例 3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 4. 20 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

30 【0586】 1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.07 (3H, s), 3.19 (2H, d, $J=7.0$ Hz), 4.14-4.25 (4H, m), 4.56 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.74 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 6.84 (4H, d, $J=8.5$ Hz), 6.95 (1H, t, $J=7.0$ Hz), 7.20-7.29 (4H, m)。

(g) 3- [4- (2-アジドエトキシ) フェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例 4 (f) で得られた 3- [4- (2-メタンスルホニルオキシエトキシ) フェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 4. 00 g およびアジ化ナトリウム 1. 93 g を用い、参考例 3 (h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3. 40 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0587】 1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.14-3.22 (2H, m), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.13 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.74 (1H, dd, $J=6.0,$

(281)

559

7.5 Hz), 6.82-6.97 (5H, m), 7.21-7.29 (4H, m)

(h) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例4 (g) で得られた3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

3.40 gと5%パラジウム-炭素 350 mgを用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3.10 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。【0588】1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.07 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 3.14-3.20 (2H, m), 3.90-4.15 (2H, m), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.74 (1H, dd, $J=6.0$, 7.0 Hz), 6.84 (4H, d, $J=8.5$ Hz), 6.94 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.19-7.30 (4H, m)。参考例5 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル(a) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル

4-イソプロピルフェノール 15.0 gをジメチルホルムアミド 63 mlとトルエン 75 ml混合溶液に溶解し、この溶液に5%油性水素化ナトリウム 5.22 gを加え、室温で1時間攪拌した。この反応溶液に2-クロロマロン酸ジメチル 18.5 gを加え、60℃で2.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルを加え、次いで酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 21.5 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。【0589】1.21 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.81-2.95 (1H, m), 3.85 (6H, s), 5.21 (1H, s), 6.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.15 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。(b) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル

参考例5 (a) で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル 21.5 g、4-ベンジルオキシベンジルクロライド 19.7 gおよび5%油性水素化ナトリウム 3.53 gを用い、参考例2

(a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 32.3 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

560

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。【0590】1.21 (6H, d, $J=6.5$ Hz), 2.79-2.92 (1H, m), 3.55 (2H, s), 3.68 (6H, s), 5.02 (2H, s), 6.86 (4H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (4H, d, $J=8.5$ Hz), 7.30-7.43 (5H, m)。(c) 2-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル

10 参考例5 (b) で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル 32.3 gと5%パラジウム-炭素 2.00 gを用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 25.2 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。20 【0591】1.21 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.75-2.95 (1H, m), 3.54 (2H, s), 3.68 (6H, s), 4.93 (1H, br s), 6.69 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.87 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.04 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。(d) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例5 (c) で得られた2-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)マロン酸ジメチル 25.2 gおよび水酸化カリウム 20.0 gを用い、参考例2 (b) に準じて反応および後処理を行なうと、結晶状の3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸を経て、シロップ状の目的化合物 19.8 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。40 【0592】1.13-1.22 (9H, m), 2.75-2.88 (1H, m), 3.11-3.18 (2H, m), 4.17 (2H, q, $J=7.5$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.5$, 7.5 Hz), 4.77 (1H, brs), 6.76 (4H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。(e) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例5 (d) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 14.8 g、2-(2-ブromoエトキシ)テトラヒドロピラン 28.2 gおよび炭酸カリウム 24.9 gを用い、参考例3 (e) に準じてジメチルホル

(282)

561

ムアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 20.6 g が得られた。

(f) 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例 5 (e) で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 20.6 g および p-トルエンスルホン酸一水和物

7.85 g を用い、参考例 3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 16.2 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0593】1.15-1.22 (9H, m), 2.75-3.00 (1H, m), 3.12-3.20 (2H, m), 3.90-3.99 (2H, m), 4.06 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.17 (2H, q, $J=7.5$ Hz), 4.69 (1H, d, $J=5.5$, 7.5 Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(g) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 5 (f) で得られた 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 16.2 g、トリエチルアミン 1.2 ml およびメタンスルホンクロライド 5.05 ml を用い、参考例 3 (g) に準じて反応お

よび後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 19.6 g が得られた。1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0594】1.16-1.23 (9H, m), 2.72-2.90 (1H, m), 3.07 (3H, s), 3.12-3.19 (2H, m), 4.10-4.23 (4H, m), 4.51-4.58 (2H, m), 4.69 (1H, dd, $J=5.5$, 7.5 Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(h) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例 5 (g) で得られた 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 19.6 g およびアジ化ナトリウム 7.06 g を用い、参考例 3

(h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ

562

状の目的化合物 15.8 g が得られた。

(i) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル
参考例 5 (h) で得られた 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 15.8 g と 5%パラジウム-炭素 1.60 g を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 13.5 g が得られた。

10 参考例 6 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

(a) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-ブチルマロン酸ジエチル

2-ブチルマロン酸ジエチル 2.16 g、4-ベンジルオキシベンジルククロライド 2.44 g および 5%油性水素化ナトリウム 480 mg を用い、参考例 2

(a) に準じて反応および後処理を行なうと、結晶性の目的化合物 3.67 g が得られた。

1) 融点 73°C

20 2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0595】0.91 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.24 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.38 (4H, m), 1.74-1.80 (2H, m), 3.18 (2H, s), 4.11-4.23 (4H, m), 5.02 (2H, s), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.31-7.44 (5H, m)。

(b) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)カブロン酸エチル

参考例 6 (a) で得られた 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-ブチルマロン酸ジエチル 3.60 g および水酸化カリウム 2.00 g を用い、参考例 2

(b) に準じて反応および後処理を行なうと、結晶性の 2-(4-ベンジルオキシベンジル)カブロン酸を経て、シロップ状の目的化合物 2.71 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0596】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.14 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.70 (6H, m), 2.51-2.72 (2H, m), 2.85 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 4.05 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.03 (2H, s), 6.88 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.31-7.45 (5H, m)。

(c) 2-(4-ヒドロキシベンジル)カブロン酸エチル

参考例 6 (b) で得られた 2-(4-ベンジルオキシベンジル)カブロン酸エチル 2.71 g および 5%パラジウム-炭素 0.40 g を用い、参考例 1 (d) に準

(283)

563

じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 90 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0597】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.35 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.53-2.72 (2H, m), 2.84 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 4.06 (2H, q, $J=7$ Hz), 4.93 (1H, s), 6.72 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(d) 2-ブチル-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例6 (c) で得られた2-(4-ヒドロキシベンジル)カブロン酸エチル 2.40 g、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン 1.63 g および炭酸カリウム 3.23 g を用い、参考例3 (e) に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2.47 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0598】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.21-1.36 (4H, m), 1.38-1.90 (8H, m), 2.51-2.63 (1H, m), 2.67 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.85 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.48-3.56 (1H, m), 3.72-3.94 (3H, m), 3.96-4.16 (4H, m), 4.70 (1H, t, $J=3.5$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(e) 2-ブチル-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例6 (d) で得られた2-ブチル-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 2.47 g およびp-トルエンスルホン酸一水和物 1.24 g を用い、参考例3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.44 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0599】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.37 (3H, m), 1.39-1.70 (3H, m), 2.08 (1H, brs), 2.51-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.89-4.00 (2H, m), 4.02-4.11 (4H, m), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(f) 2-ブチル-3-[4-(2-メタンスルホニル

564

オキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例6 (e) で得られた2-ブチル-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

1.44 g、トリエチルアミン 2.04 ml およびメタンスルホニルクロライド 0.76 ml を用い、参考例3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.65 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0600】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.39 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.52-2.61 (1H, m), 2.69 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.09 (3H, s), 4.06 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.21 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.55 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(g) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

参考例6 (f) で得られた2-ブチル-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 1.65 g およびアジ化ナトリウム 0.95 g を用い、参考例3 (h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.62 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0601】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.39 (3H, m), 1.40-1.70 (3H, m), 2.53-2.64 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.06 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.12 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(h) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

参考例6 (g) で得られた3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

1.62 g および5%パラジウム-炭素 243 mg を用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.49 g が得られた。

参考例7 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル

(a) 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)マロ

(284)

565

2-メチルマロン酸ジエチル 3. 48 g、55%油性水素化ナトリウム 0. 96 g および 3-フェニルプロピルブロマイド 3. 98 g を用い、参考例 2 (a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 4. 63 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0602】1.22 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 1.34 (3H, s), 1.50-1.63 (2H, m), 1.88-1.94 (2H, m), 2.62 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 4.16 (4H, q, $J=7.0$ Hz), 7.15-7.30 (5H, m)。

(b) 2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル

参考例 7 (a) で得られた 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル) マロン酸ジエチル 4. 63 g および水酸化カリウム 3. 55 g を用い、参考例 2 (b) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3. 18 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0603】1.14 (3H, d, $J=7.0$ Hz), 1.24 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.37-1.54 (1H, m), 1.55-1.87 (3H, m), 2.37-2.44 (1H, m), 2.61 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 4.12 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 7.10-7.35 (5H, m)。

(c) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル

ジイソプロピルアミン 3. 23 g を無水テトラヒドロフラン 60 ml に溶解し、この溶液に -60°C で 1. 65 M の n-ブチルリチウムヘキサン溶液 19. 4 ml を 20 分間かけて滴下し、 0°C で 30 分間撹拌した。再び -70°C に冷却し、参考例 7 (b) で得られた 2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル 7. 05 g を溶解した無水テトラヒドロフラン 30 ml を 20 分間かけて滴下し、 -70°C で 40 分間撹拌した。同温で 4-ベンジルオキシベンジルクロライド 9. 68 g を溶解した無水テトラヒドロフラン 80 ml を滴下し、 -70°C で 3 時間撹拌した。反応終了後、反応液に酢酸エチルと水を加え撹拌し、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下で濃縮で濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 15: 1) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 1. 88 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

566

【0604】1.06 (3H, s), 1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.38-1.87 (4H, m), 2.51-2.61 (2H, m), 2.62 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.93 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 4.08 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.01 (2H, s), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.14-7.49 (10H, m)。

(d) 2-(4-ヒドロキシベンジル)-2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル

参考例 7 (c) で得られた 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル

1. 88 g および 5%パラジウム-炭素 0. 28 g を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 58 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0605】1.06 (3H, s), 1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.35-1.85 (4H, m), 2.56-2.68 (2H, m), 2.60 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.92 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 4.09 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.18 (1H, brs), 6.68 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.05-7.36 (5H, m)。

(e) 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 7 (d) で得られた 2-(4-ヒドロキシベンジル)-2-メチル-5-フェニル吉草酸エチル 1. 58 g、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン

0. 94 g および炭酸カリウム 1. 86 g を用い、参考例 3 (e) に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 64 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0606】1.05 (3H, s), 1.21 (3H, t, $J=7.10$ Hz), 1.35-1.90 (10H, m), 2.50-2.64 (2H, m), 2.62 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.93 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.45-3.56 (1H, m), 3.67-4.15 (7H, m), 4.71 (1H, t, $J=3.5$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.96 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11-7.31 (5H, m)。

(f) 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル

参考例 7 (e) で得られた 2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 1. 64 g および p-トルエンスルホン酸-水和物 0. 68 g を用い、参考例 3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物

(285)

567

0.95 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0607】1.06 (3H, s), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.38-1.82 (4H, m), 2.04 (1H, brs), 2.56-2.65 (3H, m), 2.94 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.87-3.97 (2H, m), 3.99-4.14 (4H, m), 6.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.98 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10-7.31 (5H, m)。

(g) 3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル

参考例 7 (f) で得られた 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル 0.95 g、トリエチルアミン 1.07 ml およびメタンスルホンクロライド 0.40 ml を用い、参考例 3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.16 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0608】1.05 (3H, s), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.38-1.82 (4H, m), 2.59 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 2.62 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.94 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.08 (3H, s), 4.09 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.21 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.56 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 6.77 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.15-7.31 (5H, m)。

(h) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル

参考例 7 (g) で得られた 3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル 1.16 g およびアジ化ナトリウム 0.50 g を用い、参考例 3 (h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.86 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0609】1.06 (3H, s), 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.38-1.82 (4H, m), 2.56-2.65 (3H, m), 2.94 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.05-4.14 (4H, m), 6.78 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.15-7.31 (5H, m)。

(i) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-

568

2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル

参考例 7 (h) で得られた 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-(3-フェニルプロピル)プロピオン酸エチル 0.86 g および 5%パラジウム-炭素 129 mg を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.80 g が得られた。

参考例 8 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-

10 2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

2-フェノキシプロピオン酸エチル 6.15 g、4-ベンジルオキシベンジルクロライド 9.62 g、そしてジイソプロピルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミン 5.78 g を用い、参考例 7 (c) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物

4.97 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

20 重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0610】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 3.11 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.28 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 4.19 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.04 (2H, s), 6.75-7.02 (5H, m), 7.11-7.47 (9H, m)。

(b) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例 8 (a) で得られた 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル 4.97 g および 5%パラジウム-炭素 0.75 g を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3.85 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

40 【0611】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 3.10 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.24 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 4.20 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.13 (1H, brs), 6.74 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.96 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20 (2H, d, $J=7.5, 8.5$ Hz)。

(c) 2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 8 (b) で得られた 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.55 g、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒド

(286)

569

ロピラン 1. 08 g および炭酸カリウム 2. 14 g を用い、参考例3 (e) に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 60 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0612】 1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.39 (3H, s), 1.45-1.90 (6H, m), 3.11 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.27 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.49-3.56 (1H, m), 3.75-4.15 (5H, m), 4.20 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.71 (1H, t, $J=3.5$ Hz), 6.78-6.90 (4H, m), 6.97 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.11-7.25 (4H, m)。

(d) 3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例8 (c) で得られた2-メチル-2-フェノキシ-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 1. 60 g およびp-トルエンスルホン酸一水和物 0. 70 g を用い、参考例3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 10 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0613】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 2.09 (1H, brs), 3.11 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.28 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.91-4.00 (2H, m), 4.07 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 4.21 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.81-6.90 (4H, m), 6.97 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.13-7.28 (4H, m)。

(e) 3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例8 (d) で得られた3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1. 10 g、トリエチルアミン 0. 49 ml およびメタンスルホンクロライド 0. 25 ml を用い、参考例3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1. 42 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0614】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 3.07 (3H, s), 3.11 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.29 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 4.17-4.25 (4H, m), 4.56 (2H, t, $J=4.5$ Hz), 6.81-6.93 (4H, m), 6.98 (1H, t, $J=7.5$ Hz)

570

z), 7.17-7.26 (4H, m)。

(f) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例8 (e) で得られた3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1. 42 g およびアジ化ナトリウム 0. 66 g を用い、参考例3 (h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0. 82 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0615】 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.40 (3H, s), 3.12 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.29 (1H, d, $J=14.0$ Hz), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.13 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.20 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.82-6.89 (4H, m), 6.97 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.17-7.27 (4H, m)。

(g) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例8 (f) で得られた3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-メチル-2-フェノキシプロピオン酸エチル 0. 82 g および5%パラジウム-炭素 123 mg を用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0. 76 g が得られた。

参考例9 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル 4. 72 g と4-ベンジルオキシベンジクロライド 6. 00 g、およびジイソプロピルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミン 3. 62 g を用い、参考例7 (c) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 6. 16 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0616】 1.20 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.21 (3H, t, $J=7.5$ Hz), 1.38 (3H, s), 2.83 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.11 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.25 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 4.20 (2H, q, $J=7.5$ Hz), 5.05 (2H, s), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.18 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.30-7.45 (5H, m)。

(b) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イ

(287)

571

ソプロピルフェノキシ) - 2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9(a)で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 6.16gおよび5%パラジウム-炭素 1.00gを用い、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 4.18gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0617】1.20(6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.22(3H, t, $J=7.5$ Hz), 1.38(3H, s), 2.83(1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.10(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.24(1H, d, $J=13.5$ Hz), 4.20(2H, q, $J=7.5$ Hz), 4.81(1H, s), 6.75(4H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.13(2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例9(b)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 1.00g、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン 1.84gおよび炭酸カリウム 1.62gを用い、参考例3(e)に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.06gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0618】1.20(6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.23(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.36(3H, s), 1.48-1.90(6H, m), 2.83(1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.10(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.25(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.48-3.57(1H, m), 3.78-3.96(2H, m), 4.01-4.25(5H, m), 4.70-4.73(1H, m), 6.75(2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.86(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17(2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(d) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル)-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9(c)で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチル-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 1.06gおよびp-トルエンスルホン酸一水和物 0.60gを用い、参考例3(f)に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.66gが得られた。

572

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0619】1.20(6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.23(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.37(3H, s), 2.01(1H, t, $J=6.0$ Hz), 2.83(1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.11(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.26(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.93-4.00(2H, m), 4.05-4.10(2H, m), 4.21(2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.75(2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.19(2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(e) 2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9(d)で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル 0.66g、トリエチルアミン 0.36mlおよびメタンスルホニルクロライド 0.15mlを用い、参考例3(g)に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.64gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0620】1.20(6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.23(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.37(3H, s), 2.83(1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.09(3H, s), 3.11(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.26(1H, d, $J=13.5$ Hz), 4.21(2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.22-4.26(2H, m), 4.55-4.59(2H, m), 6.75(2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.83(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06(2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20(2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(f) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9(e)で得られた2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル 0.64gおよびアジ化ナトリウム 0.27gを用いて、参考例3(h)に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.56gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0621】1.20(6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.23(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.37(3H, s), 2.83(1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.11(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.26(1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.59(2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.14(2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.21(2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.75(2H, d, $J=8.5$ Hz)

(288)

573

z), 6.85 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(g) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9 (f) で得られた3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 0.56 gと5%パラジウム-炭素 60 mgを用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.51 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0622】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.23 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.37 (3H, s), 1.63 (2H, brs), 2.83 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.08 (2H, t, J=5.0 Hz), 3.10 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.25 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.92-4.13 (2H, m), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 6.75 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.18 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例10 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチル-2-メチルプロピオン酸エチル

(a) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-メチルカプロン酸エチル

参考例6 (b) で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)カプロン酸エチル 2.04 gと4-ベンジルオキシベンジルクロライドの代わりにヨウ化メチル

1.12 ml、およびジイソプロピルアミンの代わりにシクロヘキシルイソプロピルアミン 1.748 mlを用い、参考例7 (c) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.80 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0623】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.45 (8H, m), 1.63-1.79 (1H, m), 2.63 (1H, d, J=13.5 Hz), 2.96 (1H, d, J=13.5 Hz), 4.10 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.03 (2H, s), 6.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.02 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.46 (5H, m)。

(b) 2-ブチル-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例10 (a) で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-メチルカプロン酸エチル 3.95 gおよび5%パラジウム-炭素 0.40 gを用い、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2.95 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

574

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0624】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.45 (8H, m), 1.62-1.79 (1H, m), 2.61 (1H, d, J=13.5 Hz), 2.95 (1H, d, J=13.5 Hz), 4.10 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.80 (1H, brs), 6.71 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.96 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 2-ブチル-2-メチル-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例10 (b) で得られた2-ブチル-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルプロピオン酸エチル 2.95 g、2-(2-ブromoエトキシ)テトラヒドロピラン 4.66 gおよび炭酸カリウム 4.62 gを用い、参考例3 (e) に準じてジメチルアセトアミド中での反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 4.18 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0625】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.05 (3H, s), 1.11-1.43 (8H, m), 1.47-1.90 (7H, m), 2.62 (1H, d, J=13.5 Hz), 2.95 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.48-3.57 (1H, m), 3.64-4.18 (7H, m), 4.67-4.72 (1H, m), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.00 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(d) 2-ブチル-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例10 (c) で得られた2-ブチル-2-メチル-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 4.18 gおよびp-トルエンスルホン酸一水和物 2.61 gを用いて、参考例3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2.73 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0626】0.90 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.47 (8H, m), 1.65-1.78 (1H, m), 2.04 (1H, brs), 2.63 (1H, d, J=13.5 Hz), 2.96 (1H, d, J=13.5 Hz), 3.91-3.98 (2H, m), 4.04-4.17 (4H, m), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.02 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(e) 2-ブチル-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例10 (d) で得られた2-ブチル-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-2-メチルブ

(289)

575

ロピオン酸エチル 2. 73 g、トリエチルアミン

1. 85 ml およびメタンスルホニルクロライド 0. 75 ml を用い、参考例 3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3. 17 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0627】0.89 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.44 (8H, m), 1.66-1.80 (1H, m), 2.62 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.97 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.08 (3H, s), 4.11 (2H, q, $J=7.5$ Hz), 4.20-4.23 (2H, m), 4.54-4.58 (2H, m), 6.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.03 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(f) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-ブチル-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例 10 (e) で得られた 2-ブチル-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]-2-メチルプロピオン酸エチル 3. 17 g およびアジ化ナトリウム 1. 60 g を用い、参考例 3 (h) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2. 80 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0628】0.90 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.44 (8H, m), 1.66-1.78 (1H, m), 2.63 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.96 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.11 (2H, q, $J=7.5$ Hz), 4.12 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.03 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(g) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチル-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例 10 (f) で得られた 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-ブチル-2-メチルプロピオン酸エチル 2. 73 g および 5% パラジウム-炭素 270 mg を用い、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2. 42 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0629】0.89 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.06 (3H, s), 1.10-1.43 (9H, m), 1.71 (2H, brs), 2.62 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 2.96 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.07 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 3.91-4.10 (2H, m), 4.11 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.01 (2H, d, $J=8.5$ Hz)

576

z)。

参考例 11 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

(a) 4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニル酸メチル

4'-ホルミルビフェニル-4-カルボン酸メチル

2. 00 g をメタノール 20 ml に溶解し、室温にてオルトギ酸メチル 4. 55 ml およびアンバーリスト 15 200 mg を加え、室温にて 14 時間放置した。樹脂を濾去後、濾液を減圧濃縮し、過剰の試薬をトルエンを用いて共沸留去した。ジイソプロピルエーテルから結晶化することによって、無色結晶の目的化合物 2. 23 g が得られた。

1) 融点 76-77°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0630】3.37 (6H, s), 3.94 (3H, s), 5.45 (1H, s), 7.55 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.64 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.67 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(b) 4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニル酸

参考例 11 (a) で得られた 4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル 1. 89 g および 1N 水酸化ナトリウム水溶液 9. 90 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 1. 80 g が得られた。

1) 融点 164°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0631】3.28 (6H, s), 5.45 (1H, s), 7.51 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 1. 81 g、参考例 11 (b) で得られた 4'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸 1. 68 g およびカルボニルジイミダゾール 1. 20 g を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行い、薄褐色固体状の目的化合物 2. 77 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ

(290)

577

ラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0632】0.86(3H, t, J=7.0 Hz), 1.16(3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.36(4H, m), 1.38-1.49(1H, m), 1.51-1.71(1H, m), 2.52-2.63(1H, m), 2.68(1H, d, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86(1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.36(6H, s), 3.88(2H, q, J=5.0 Hz), 4.05(2H, q, J=7.0 Hz), 4.14(2H, t, J=5.0 Hz), 5.45(1H, s), 6.65(1H, brt), 6.83(2H, d, J=8.5 Hz), 7.08(2H, d, J=8.5 Hz), 7.54(2H, d, J=8.5 Hz), 7.62(2H, d, J=8.5 Hz), 7.66(2H, d, J=8.5 Hz), 7.85(2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例12 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシカルボニルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 375mg、4'-メトキシカルボニルビフェニル-4-カルボン酸 328mgおよびカルボニルジイミダゾール 255mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 257mgが得られた。

1) 融点 93-95℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0633】0.86(3H, t, J=6.5 Hz), 1.16(3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.36(4H, m), 1.40-1.67(2H, m), 2.52-2.63(1H, m), 2.68(1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.88(1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.89(2H, t, J=5.0 Hz), 3.95(3H, s), 4.05(2H, q, J=7.0 Hz), 4.15(2H, t, J=5.0 Hz), 6.63(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8.5 Hz), 7.09(2H, d, J=8.5 Hz), 7.68(2H, d, J=8.5 Hz), 7.69(2H, d, J=8.5 Hz), 7.88(2H, d, J=8.5 Hz), 8.12(2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例13 3'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸

3'-メトキシビフェニル-4-カルボン酸メチル 2.00gを無水ジクロロメタン 10mlに溶解した。この溶液に、-70℃にて1N三臭化ホウ素・ジクロロメタン溶液 24.8mlを加えた。室温にて4時間攪拌後、氷冷下氷水を加え、30分間攪拌した。この反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。ヘキサソ-ジイソプロピルエーテルの混合溶液から結晶化を行なうと、淡黄色結晶の目的化合物 1.82gが得られた。

1) 融点 250-253℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

578

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0634】6.89(1H, d, J=8.0 Hz), 7.11(1H, d, J=8.0 Hz), 7.13(1H, s), 7.28(1H, t, J=8.0 Hz), 7.64(2H, d, J=8.5 Hz), 8.12(2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例14 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

(a) 3'-ホルミルビフェニル-4-カルボン酸メチル

3-ホルミルフェニルホウ酸 3.00gおよび4-ブプロモ安息香酸メチル 4.30gをトルエン 30ml、エタノール 50mlおよび飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 30mlの混合溶液に溶解し、室温下、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 297mgを加え、100℃にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。ジイソプロピルエーテルにて結晶化することによって、無色結晶の目的化合物 3.37gが得られた。

1) 融点 95-97℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0635】3.96(3H, s), 7.65(1H, d, J=7.5 Hz), 7.70(2H, d, J=8.5 Hz), 7.88-7.93(2H, m), 8.14(1H, s), 8.15(2H, d, J=8.5 Hz), 10.11(1H, s)。

(b) 3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル

参考例14(a)で得られた3'-ホルミルビフェニル-4-カルボン酸メチル 1.60g、オルトギ酸メチル 3.64mlおよびアンバーリスト15160mgを用い、参考例11(a)に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 1.91gが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0636】3.37(6H, s), 3.94(3H, s), 5.46(1H, s), 7.47(1H, d, J=4.5 Hz), 7.49(1H, d, J=2.5 Hz), 7.57-7.64(1H, m), 7.68(2H, d, J=8.5 Hz), 7.72(1H, s), 8.11(2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸

参考例14(b)で得られた3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル 1.91gおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 10.0mlを用い、実施

(291)

579

例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 1.55 g が得られた。

1) 融点 130-131℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0637】3.38 (6H, s), 5.48 (1H, s), 7.49 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.49 (1H, d, J=3.5 Hz), 7.59-7.66 (1H, m), 7.73 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.75 (1H, s), 8.19 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(d) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 1.55 g、参考例14(c)で得られた3'-ジメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸 1.44 g およびカルボニルジイミダゾール 1.03 g を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、シロップ状の目的化合物 2.72 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0638】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.35 (4H, m), 1.39-1.56 (1H, m), 1.58-1.67 (1H, m), 2.53-2.65 (1H, m), 2.69 (1H, d, J=6.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.37 (6H, s), 3.89 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.06 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 5.45 (1H, s), 6.64 (1H, brt), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.47 (1H, d, J=3.0 Hz), 7.54-7.61 (1H, m), 7.68 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.71 (1H, s), 7.85 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例15 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸・ナトリウム塩

(a) 3'-ヒドロキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル

参考例14(a)で得られた3'-ホルミルビフェニル-4-カルボン酸メチル 720 mg をエタノール 50 ml に溶解し、室温にて水素化ホウ素ナトリウム 132 mg を加え、窒素雰囲気下50分間攪拌した。反応液に50%酢酸を加え過剰の試薬を分解後、反応液を減圧濃縮した。残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。ジイソプロピルエーテルにて結晶化することによって、無色結晶の目的化合物 522 mg が得られた。

580

1) 融点 88-89℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0639】3.95 (3H, s), 4.79 (2H, s), 7.40 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.47 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.56 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.64 (1H, s), 7.67 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.11 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(b) 3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル

参考例15(a)で得られた3'-ヒドロキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル 504 mg を無水ジクロロメタン 10 ml に溶解し、0℃にてクロロメチルメチルエーテル 0.24 ml およびジイソプロピルエチルアミン 0.74 ml を加え、同温にて1時間攪拌後、室温にて14時間放置した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) にて精製すると、無色結晶の目的化合物 467 mg が得られた。

1) 融点 54-55℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0640】3.44 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.67 (2H, s), 4.75 (2H, s), 7.39 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.46 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.56 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.63 (1H, s), 7.67 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.11 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸

参考例15(b)で得られた3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル 445 mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 3.10 ml を用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 342 mg が得られた。

1) 融点 126-127℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0641】3.45 (3H, s), 4.68 (2H, s), 4.76 (2H, s), 7.41 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.47 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.58 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.64 (1H, s), 7.71 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.17 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(d) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシ

(292)

581

シメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)
エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル

参考例6で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 358mg、参考例15(c)で得られた3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボン酸 333mgおよびカルボニルジイミダゾール 238mgを用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、茶色シロップ状の目的化合物 573mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0642】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.39 (4H, m), 1.40-1.51 (1H, m), 1.54-1.67 (1H, m), 2.53-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, d, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.44 (3H, s), 3.88 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.05 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.67 (2H, s), 4.74 (2H, s), 6.69 (1H, brt), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.38 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.45 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.54 (2H, d, $J=7.5$ Hz), 7.60 (1H, s), 7.66 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(e) 2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ] フェニル] プロピオン酸・ナトリウム塩

参考例15(d)で得られた2-ブチル-3-[4-[2-(3'-メトキシメトキシメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ] フェニル] プロピオン酸エチル 573mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 2.00mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物472mgが得られた。

1) 融点 216-218°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0643】0.85 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.17-1.40 (4H, m), 1.46-1.60 (2H, m), 2.36-2.46 (1H, m), 2.52 (1H, dd, $J=7.0$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=7.5$, 13.5 Hz), 3.41 (3H, s), 3.77 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.14 (2H, t, $J=5.5$ Hz), 4.66 (2H, s), 4.73 (2H, s), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.13 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.38 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.45 (1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.60 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.66 (1H, s), 7.72 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例16 2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸

582

2'-ヒドロキシビフェニル-4-カルボン酸メチル 498mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 4.84mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 434mgが得られた。

1) 融点 176-178°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム-重メタノール (20:1) の混合溶液中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0644】6.92-7.05 (2H, m), 7.21-7.32 (2H, m), 7.64 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.15 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例17 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ] フェニル] プロピオン酸

(a) 4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル

マグネシウム 327mgを無水テトラヒドロフラン 45mlに懸濁し、この懸濁液に65°Cにて5-ブromo-2-メトキシメトキシ-1, 3-ジメチルベンゼン

3.35gを溶解したテトラヒドロフラン溶液 7.0mlを15分間かけて滴下し、80°Cにて1時間攪拌して、グリニアル化合物を調製した。この反応液をホウ酸トリメチル 2.00mlを溶解した無水ジエチルエーテル溶液20mlに、-50°Cにて30分間かけて滴下した。室温で2時間攪拌後、反応液に硫酸水素カリウム水溶液を加え反応を停止させ、酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をジイソプロピルエーテルにて結晶化させることによって、無色結晶の4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルフェニルホウ酸 1.04gが得られた。得られた4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルフェニルホウ酸 1.04g、4-ブromo安息香酸メチル 1.06gおよびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 96mgを用い、参考例14

(a)に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 1.36gが得られた。

1) 融点 100-101°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0645】2.37 (6H, s), 3.64 (3H, s), 3.93 (3H, s), 5.01 (2H, s), 7.28 (2H, s), 7.61 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(b) 4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸

参考例17(a)で得られた4'-メトキシメトキシ-

3'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルフェニルホウ酸 1.04g、4-ブromo安息香酸メチル 1.06gおよびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 96mgを用い、参考例14

(a)に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 1.36gが得られた。

(b) 4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸

参考例17(a)で得られた4'-メトキシメトキシ-

(293)

583

3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸メチル
1. 24 g および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 8.
20 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を
行なうと、無色結晶の目的化合物 0.99 g が得られ
た。

1) 融点 153-154°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ
ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル
(270 MHz) は次の通りである。

【0646】2.38 (6H, s), 3.64 (3H, s), 5.02 (2
H, s), 7.30 (2H, s), 7.65 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.1
4 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシ
シメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カル
ボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチ
ル

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)
フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 880 m
g、参考例 17 (b) で得られた 4'-メトキシシメトキ
シ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸
859 mg およびカルボニルジイミダゾール 577 m
g を用いて、実施例 5 に準じて反応および後処理を行
い、無色結晶の目的化合物 1.18 g が得られた。

1) 融点 70-71°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ
ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル
(270 MHz) は次の通りである。

【0647】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.22-1.40 (4H, m), 1.74-1.77 (2H, m), 2.36 (6H, s), 2.52-2.63 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.0, 13.5 Hz), 3.63 (3H, s), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 5.00 (2H, s), 6.62 (1H, brt), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(d) 2-ブチル-3-[4-[2-(4'-メトキシ
シメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カル
ボニルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸

参考例 17 (c) で得られた 2-ブチル-3-[4-[
2-(4'-メトキシシメトキシ-3', 5'-ジメチル
ビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニ
ル]プロピオン酸エチル 1.01 g および 1 N 水酸化
ナトリウム水溶液 3.60 ml を用い、実施例 2 に準じ
て反応および後処理を行なうと、フォーム状粉末の目
的化合物 1.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ

584

ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル
(270 MHz) は次の通りである。

【0648】0.87 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.39 (4
H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.35 (6H, s), 2.56-2.65
(1H, m), 2.71 (1H, dd, J=6.5, 13.5 Hz), 2.89 (1H,
dd, J=8.5, 13.5 Hz), 3.63 (3H, s), 3.86 (2H, q,
J=5.0 Hz), 4.12 (2H, t, J=5.0 Hz), 5.00 (2H, s),
6.73 (1H, brt), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H,
d, J=8.5 Hz), 7.58 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.81 (2H,
d, J=8.5 Hz)。

参考例 18 6-イソプロポキシニコチン酸

(a) 6-イソプロポキシニコチン酸イソプロピル

6-クロロニコチノイルクロライド 1.56 g をイソ
プロパノール 20 ml に溶解した。この溶液に、炭酸
セシウム 7.94 g を加え、3 時間加熱還流した。こ
の反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加
え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾
燥後、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマ
トグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) にて精
製を行なうと、無色液体の目的化合物 143 mg が得
られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ
ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル
(270 MHz) は次の通りである。

【0649】1.36 (12H, d, J=6.5 Hz), 5.24 (1H, se
ptet, J=6.5 Hz), 5.39 (1H, septet, J=6.5 Hz), 6.68
(1H, d, J=8.5 Hz), 8.12 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz),
8.81 (1H, d, J=2.5 Hz)。

(b) 6-イソプロポキシニコチン酸

参考例 18 (a) で得られた 6-イソプロポキシニコチ
ン酸イソプロピル 130 mg および 1 N 水酸化ナトリ
ウム水溶液 0.87 ml を用い、実施例 2 に準じて反
応および後処理を行なうと、結晶性の目的化合物 10
6 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシ
ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル
(270 MHz) は次の通りである。

【0650】1.38 (6H, d, J=6.0 Hz), 5.42 (1H, sep
tet, J=6.0 Hz), 6.73 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.18 (1H,
dd, J=2.5, 8.5 Hz), 8.92 (1H, d, J=2.5 Hz)。

参考例 19 2-ブチル-3-[4-[2-(3-フェ
ニルプロピルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン
酸エチル

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)
フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 500 m
g をエタノール 10 ml に溶解し、この溶液に、室温
にて、3-フェニルプロピオンアルデヒド 0.23 m
l、水素化シアノホウ素ナトリウム 117 mg および

(294)

585

酢酸 1 滴を加えた。室温にて、18 時間攪拌後、反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン：メタノール＝19：1）に付して精製すると、淡黄色油状の目的化合物 460 mg が得られた。1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm

重クロロホルム中、内部標準に TMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0651】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.15 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.23-1.32 (4H, m), 1.40-1.95 (4H, m), 2.52-3.00 (9H, m), 3.99-4.09 (4H, m), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.15-7.31 (5H, m)。

参考例 20 2-ブチル-3-[4-[2-(ブチルアミノ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 6 で得られた 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 500 mg、ブチルアルデヒド 0.15 ml、水素化シアノホウ素ナトリウム 107 mg および酢酸 1 滴を用い、参考例 19 に準じて反応および後処理を行なうと、黄色油状の目的化合物 390 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準に TMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0652】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 0.94 (3H, t, $J=7.5$ Hz), 1.17 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.73 (10H, m), 2.52-3.00 (5H, m), 3.20-3.28 (2H, m), 3.99-4.20 (4H, m), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例 21 3-[4-(3-アミノプロポキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

(a) 2-ブチル-3-[4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)プロポキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 6 (c) で得られた 2-(4-ヒドロキシベンジル)カブロン酸エチル 3.02 g、2-(3-プロモプロポキシ)テトラヒドロピラン 3.23 g および炭酸カリウム 5.00 g を用いて、参考例 3 (e) に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 4.42 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準に TMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0653】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.15 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.35 (4H, m), 1.47-1.88 (8H, m),

586

2.06 (2H, quintuplet, $J=6.0$ Hz), 2.52-2.63 (1H, m), 2.67 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.85 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.46-3.61 (2H, m), 3.80-3.97 (2H, m), 4.01-4.10 (4H, m), 4.60 (1H, t, $J=3.5$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(b) 2-ブチル-3-[4-(3-ヒドロキシプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 21 (a) で得られた 2-ブチル-3-[4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)プロポキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 4.42 g および p-トルエンスルホン酸一水和物 2.57 g を用いて、参考例 3 (f) に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 3.02 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準に TMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0654】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.35 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 1.77 (1H, t, $J=5.5$ Hz), 2.03 (2H, quintuplet, $J=5.5$ Hz), 2.53-2.65 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.86 (2H, q, $J=5.5$ Hz), 4.02-4.17 (4H, m), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 2-ブチル-3-[4-(3-メタンスルホニルオキシプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例 21 (b) で得られた 2-ブチル-3-[4-(3-ヒドロキシプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 3.02 g、トリエチルアミン 2.05 ml およびメタンスルホンクロライド 0.83 ml を用いて、参考例 3 (g) に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 3.49 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準に TMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0655】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.34 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.21 (2H, quintuplet, $J=6.0$ Hz), 2.52-2.64 (1H, m), 2.68 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.86 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 2.98 (3H, s), 4.02-4.11 (4H, m), 4.44 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(d) 3-[4-(3-アジドプロポキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル

参考例 21 (c) で得られた 2-ブチル-3-[4-(3-メタンスルホニルオキシプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 2.98 g およびアジ化ナトリウム 1.50 g を用いて、参考例 3 (h) に準じて反応および後処理を行なう

(295)

587

と、無色油状の目的化合物 2. 45 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0656】0.87 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.20-1.34 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 2.03 (2H, quintuplet, $J=6.5$ Hz), 2.51-2.63 (1H, m), 2.67 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 2.85 (1H, dd, $J=8.5$, 13.5 Hz), 3.51 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 4.02 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 4.05 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(e) 3-[4-(3-アミノプロポキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 参考例21(d)で得られた3-[4-(3-アジドプロポキシ)フェニル]-2-ブチルプロピオン酸エチル 2.45 g と5%パラジウム-炭素250 mg を用い、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 1.62 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0657】0.87 (3H, t, $J=6.5$ Hz), 1.16 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.34 (4H, m), 1.40-1.70 (2H, m), 1.80-2.10 (2H, m), 2.52-2.94 (6H, m), 4.00-4.11 (4H, m), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例2-2-2-ブチル-3-[4-(3-メチルアミノプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例2-1-(c)で得られた2-ブチル-3-[4-(3-メタンсульホニルオキシプロポキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 500 mg をトルエン 10 ml に溶解し、この溶液に40%メチルアミン・メタノール溶液 5.0 ml 加え、90℃にて2日間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=5:1) に付して精製すると、淡黄色油状の目的化合物 389 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0658】0.87 (3H, t, $J=6.5$ Hz), 1.15 (1.5H, t, $J=7.0$ Hz), 1.16 (1.5H, t, $J=7.0$ Hz), 1.22-1.35 (4H, m), 1.42-1.70 (2H, m), 1.92-2.02 (1H, m), 2.17-2.27 (1H, m), 2.52-3.09 (8H, m), 3.92-4.10 (4H, m), 6.73-6.81 (2H, m), 7.00-7.09 (2H, m)。

588

参考例23 3-[4-(2- t -ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-プロピルプロピオン酸エチル

(a) 2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-プロピルマロン酸ジエチル

2-プロピルマロン酸ジエチル 5.00 g、4-ベンジルオキシベンジルククロライド 6.32 g および55%油性水素化ナトリウム 1.13 g を用い、参考例2(a)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 9.80 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0659】0.92 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.23 (6H, t, $J=7.0$ Hz), 1.23-1.38 (2H, m), 1.71-1.80 (2H, m), 3.18 (2H, s), 4.08-4.21 (4H, m), 5.02 (2H, s), 6.86 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.99 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.30-7.48 (5H, m)。

(b) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸

参考例23(a)で得られた2-(4-ベンジルオキシベンジル)-2-プロピルマロン酸ジエチル 9.85 g および水酸化カリウム 5.25 g を用いて、参考例2(b)に準じて反応および後処理を行なうと、茶色結晶の目的化合物 3.96 g が得られた。1) 融点 83-85℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0660】0.90 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.24-1.70 (4H, m), 2.59-3.00 (3H, m), 5.03 (2H, s), 6.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21-7.48 (5H, m)。

(c) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸エチル

参考例23(b)で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸 3.90 g をN,N-ジメチルホルムアミド 40 ml に溶解し、この溶液に1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン 2.34 ml およびヨウ化エチル 1.57 ml を加え、60℃で4時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=5:1~4:1) に付して精製すると、無色油状の目的化合物 4.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシ

(296)

589

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0661】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.14 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.70 (4H, m), 2.56-2.62 (1H, m), 2.68 (1H, dd, J=6.0, 13.0 Hz), 2.86 (1H, dd, J=8.0, 13.0 Hz), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.03 (2H, s), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.28-7.47 (5H, m)。

(d) 3-[4-(4-ヒドロキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸エチル]

参考例23(c) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸エチル 4.00 g および5%パラジウム-炭素 0.40 g を用い、参考例1(d) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 3.10 g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0662】0.89 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.21-1.70 (4H, m), 2.53-2.72 (2H, m), 2.84 (1H, dd, J=8.5, 13.0 Hz), 4.05 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.75-4.82 (1H, m), 6.72 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.02 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(e) 3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-プロピルプロピオン酸エチル

参考例23(d) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸エチル 1.65 g、2-ヒドロキシアセチルカルバミン酸tert-ブチルエステル 5.63 g、ナトリウムフェニルホスフィン 9.16 g およびジエチルアゾジカルボキシレート 6.14 ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 2.22 g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0663】0.88 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.20-1.70 (4H, m), 1.45 (9H, s), 2.55-2.71 (2H, m), 2.86 (1H, dd, J=8.0, 13.0 Hz), 3.51 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.90-4.15 (4H, m), 4.93-5.03 (1H, m), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例24 3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

(a) 3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-

590

3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例4で得られた3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 2.07 g、参考例17(b) で得られた4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボン酸 1.50 g およびカルボニルジイミダゾール 1.10 g を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 720 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0664】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.36 (6H, s), 3.18 (1H, d, J=5.5 Hz), 3.19 (1H, d, J=7.5 Hz), 3.64 (3H, s), 3.88 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.74 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 5.00 (2H, s), 6.61 (1H, brt), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.20-7.30 (6H, m), 7.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(b) 3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸

参考例24(a) で得られた3-[4-[2-(4'-メトキシメトキシ-3', 5'-ジメチルビフェニル-4-カルボニルアミノ)エトキシ]フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル 720 mg および1N水酸化ナトリウム水溶液 2.40 ml を用いて、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 520 mg が得られた。

1) 融点 142-143°C

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重メタノール中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0665】2.35 (6H, s), 3.14 (1H, d, J=7.5 Hz), 3.16 (1H, d, J=4.5 Hz), 3.60 (3H, s), 3.77 (2H, q, J=5.5 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.5 Hz), 4.86 (1H, d, J=4.5, 7.5 Hz), 5.00 (2H, s), 6.83 (2H, d, J=7.5 Hz), 6.86-6.93 (1H, m), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=7.5 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.33 (2H, s), 7.65 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.86 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.68 (1H, brt)。

参考例25 3-[4-(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例5(d) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-プロピルプロピオン酸エチル 1.65 g、2-ヒドロキシアセチルカルバミン酸tert-ブチルエステル 5.63 g、ナトリウムフェニルホスフィン 9.16 g およびジエチルアゾジカルボキシレート 6.14 ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 2.22 g が得られた。

(297)

591

ル) - 2 - (4-イソプロピルフェノキシ) プロピオン酸エチル 18.2 g を N, N-ジメチルホルムアミド 200 ml とトルエン 100 ml の混合溶液に溶解し、室温にて炭酸カリウム 23.5 g を加えた。この懸濁液に、70℃にて、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 12.2 g を溶解したトルエン溶液 40 ml を滴下し、同温にて2時間攪拌した後、さらに反応溶液に2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 12.2 g を溶解した N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml とトルエン 40 ml の混合溶液を追加し、70℃にて一晩攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (トルエン: 酢酸エチル = 20 : 1 → ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) にて精製すると、無色油状の目的化合物 18.7 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0666】1.19 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.45 (9H, s), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.16 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.18 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.52 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.99 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.0, 7.5$ Hz), 4.97 (1H, brt), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例 26-6-(4-メトキシフェニル)-ニコチン酸 6-(4-メトキシフェニル)ニコチン酸メチル 3.95 g および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 3.2 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 2.63 g が得られた。

1) 融点 252-253℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0667】3.84 (3H, s), 7.08 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.04 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.14 (2H, d, $J=9.0$ Hz), 8.27 (1H, dd, $J=2.5, 8.5$ Hz), 9.09 (1H, d, $J=2.5$ Hz)。

参考例 27 6-(4-フルオロフェニル)ニコチン酸 6-(4-フルオロフェニル)ニコチン酸メチル 390 mg および 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 5.00 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、淡黄色固体の目的化合物 345 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル

592

(270 MHz) は次の通りである。

【0668】7.35 (2H, t, $J=8.5$ Hz), 8.11 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.15-8.29 (2H, m), 8.32 (1H, dd, $J=2.0, 8.5$ Hz), 9.13 (1H, d, $J=2.0$ Hz)。

参考例 28 6-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ニコチン酸

2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロパノール 5.23 ml, 55% 油状水素化ナトリウム 1.91 g および 6-クロロニコチン酸メチル 5.00 g を用い、参考例 1 (c) に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の 6-(2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ)ニコチン酸メチルを含む混合物 5.42 g が得られた。この混合物 2.70 g および 2 N 水酸化ナトリウム水溶液 15.0 ml を用い、実施例 2 に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物を含む混合物 1.60 g が得られた。この混合物をさらに精製することなく、実施例 102 および 150 の反応に用いた。

参考例 29 (S)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸 2-トリメチルシリルエチル

(a) (S)-4-ベンジル-3-[4-(4-イソプロピルフェノキシ)アセチル]オキサゾリジン-2-オン 4-イソプロピルフェノキシ酢酸 15.0 g をジクロロメタン 75 ml に溶解し、室温にてオキサリルクロライド 16.8 ml および N, N-ジメチルホルムアミド 3 滴を加え、1.5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残留物にトルエンを加え、過剰の試薬を共沸留去し、減圧下 1 時間乾燥した。

【0669】(S)-4-ベンジルオキサゾリジン-2-オン 12.4 g をテトラヒドロフラン 150 ml に溶解し、-78℃にて 1.61 N *n*-ブチルリチウム・ヘキサン溶液 48.0 ml を滴下し、同温にてさらに 30 分間攪拌した。この反応溶液に、-78℃にて、先に調製した 4-イソプロピルフェノキシアセチルクロライドを溶解したテトラヒドロフラン溶液 100 ml を加え、0℃にて 1 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を 1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をヘキサン-酢酸エチル (6 : 1) の混合溶液から結晶化すると、無色結晶の目的化合物 20.9 g が得られた。

1) 融点 104.5-105℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0670】1.23 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.79-2.92 (2

(298)

593

H, m), 3.36 (1H, dd, J=3.0, 13.5 Hz), 4.24-4.37 (2H, m), 4.68-4.78 (1H, m), 5.22 (2H, s), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13-7.38 (7H, m)。

(b) (S)-4-ベンジル-3-[(2S, 3R)-3-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-ヒドロキシ-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例29(a)で得られた(S)-4-ベンジル-3-[(4-イソプロピルフェノキシ)アセチル]オキサゾリジン-2-オン 20.0gをジクロロメタン 150mlに溶解し、0℃にて1Mジブチルボロントリフルート・ジクロロメタン溶液 67.9mlおよびトリエチルアミン 10.2mlを加え、同温にて1時間攪拌した。反応液を-78℃に冷却後、4-ベンジルオキシベンズアルデヒド 13.2gを溶解したジクロロメタン溶液 20mlを滴下し、同温にて40分間攪拌した。0℃にてさらに1時間攪拌後、反応液に飽和食塩水-メタノール(1:1)の混合溶液 50ml、次いで31%過酸化水素水-メタノール(2:1)の混合溶液 150mlを加え、さらに1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1~1:1)にて精製を行なうと、フォーム状の目的化合物 25.7gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz)は次の通りである。

【0671】1.20 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.73 (1H, dd, J=9.5, 13.5 Hz), 2.85 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.07 (1H, dd, J=3.0, 13.5 Hz), 3.58 (1H, t, J=8.5 Hz), 3.97 (1H, d, J=9.0 Hz), 4.23-4.29 (1H, m), 5.04 (2H, s), 5.09 (1H, d, J=5.5 Hz), 6.18 (1H, d, J=5.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.05-7.10 (2H, m), 7.14 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.44 (10H, m)。

(c) (S)-4-ベンジル-3-[(2S, 3R)-3-ヒドロキシ-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例29(b)で得られた(S)-4-ベンジル-3-[(2S, 3R)-3-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-ヒドロキシ-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 25.0gと5%パラジウム-炭素 2.50gを用いて、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行うと、フォーム状の目的化合物 19.1gが得られた。

594

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0672】1.21 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.76 (1H, dd, J=9.0, 13.5 Hz), 2.85 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.07 (1H, dd, J=3.0, 13.5 Hz), 3.17 (1H, d, J=4.5 Hz), 3.73 (1H, t, J=8.5 Hz), 4.04 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.25-4.35 (1H, m), 5.07 (1H, t, J=5.0 Hz), 5.52 (1H, s), 6.18 (1H, d, J=5.5 Hz), 6.78 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.02-7.12 (2H, m), 7.14 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.22-7.29 (3H, m), 7.32 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(d) (S)-4-ベンジル-3-[(S)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例29(c)で得られた(S)-4-ベンジル-3-[(2S, 3R)-3-ヒドロキシ-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 18.0gをトリフルオロ酢酸 150mlに溶解し、室温にてトリエチルシラン 30.2mlを加え、18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、1N塩酸および飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて精製を行なうと、無色結晶の目的化合物 10.7gが得られた。

1) 融点 142-143℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz)は次の通りである。

【0673】1.19 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.75-2.88 (2H, m), 3.10-3.21 (3H, m), 4.03 (1H, t, J=8.0 Hz), 4.17 (1H, d, J=9.0 Hz), 4.48-4.55 (1H, m), 4.89 (1H, s), 6.08 (1H, dd, J=5.5, 8.0 Hz), 6.74 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.05-7.16 (4H, m), 7.21-7.36 (5H, m)。

(e) (S)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例29(d)で得られた(S)-4-ベンジル-3-[(S)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 10.6gをメタノール 140mlおよびテトラヒドロフラン 15mlの混合溶液に懸濁し、0℃にて1N水酸化リチウム水溶液 57.0mlおよび31%過酸化水素水 6.34mlの混合溶

(299)

595

液を滴下した。室温にて6時間攪拌後、亜ジチオン酸ナトリウム 10.1 gを溶解した水50 mlを反応液に加え、さらに1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に1 N水酸化ナトリウムを加え、水層をアルカリ性とし、ジクロロメタンで洗浄した。水層を1 N塩酸で酸性とし、酢酸エチルを加え、酢酸エチル層を分離後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。ヘキサンより結晶化することによって、白色粉末の(S)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 6.00 gが得られた。このカルボン酸4.43 gをジクロロメタン 100 mlに懸濁し、室温にてオキサリルクロライド 5.50 mlおよびN,N-ジメチルホルムアミド5滴を加え、1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、トルエンにて過剰の試薬を共沸留去した。この残留物をジクロロメタン 50 mlに溶解し、この溶液に2-トリメチルシリルエタノール 9.06 mlを加え、室温にて15時間攪拌した。この反応液にトリエチルアミン 4.40 mlおよび4-N,N-ジメチルアミノピリジン155 mgを加え、室温にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1~4:1)にて精製を行なうと、淡黄色油状の目的化合物 5.30 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270 MHz)は次の通りである。

【0674】0.00 (9H, s), 0.92 (2H, t, J=8.5 Hz), 1.18 (6H, d, J=7.0 Hz), 2.81 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.10-3.17 (2H, m), 4.19 (2H, t, J=8.5 Hz), 4.66 (1H, dd, J=6.0, 7.0 Hz), 6.73 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.74 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(f) (S)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例29(e)で得られた(S)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル 4.80 g、2-メタンスルホンオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 7.17 gおよび炭酸カリウム 8.28 gを用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 5.94 gが得られた。

1) $[\alpha]_D^{25}$ -6.0° (c=0.9、クロロホルム)

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

596

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(400 MHz)は次の通りである。

【0675】0.00 (9H, s), 0.91 (2H, t, J=8.5 Hz), 1.17 (6H, d, J=7.0 Hz), 1.45 (9H, s), 2.81 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.08-3.18 (2H, m), 3.45-3.54 (2H, m), 3.93-4.00 (2H, m), 4.10-4.25 (2H, m), 4.65 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 4.93-5.00 (1H, m), 6.74 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.80 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(g) (S)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例29(f)で得られた(S)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル 0.95 g、4-(2-ピリジル)安息香酸382 mg、シアノリン酸ジエチル

0.29 mlおよびトリエチルアミン0.53 mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 0.62 gが得られた。

1) $[\alpha]_D^{25}$ -3.0° (c=0.7、クロロホルム)

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(400 MHz)は次の通りである。

【0676】0.05 (9H, s), 0.97 (2H, t, J=8.5 Hz), 1.15-1.23 (6H, m), 2.86 (1H, septet, J=7.0 Hz), 3.14-3.23 (2H, m), 3.85-3.95 (2H, m), 4.15-4.27 (4H, m), 4.70 (1H, dd, J=5.5, 7.5 Hz), 6.64-6.74 (1H, m), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.24-7.34 (3H, m), 7.76-7.84 (2H, m), 7.93 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.11 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.76 (1H, d, J=5.0 Hz)。

参考例30 (R)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

(a) (R)-4-ベンジル-3-[4-(4-イソプロピルフェノキシ)アセチル]オキサゾリジン-2-オン 4-イソプロピルフェノキシ酢酸 14.1 g、オキサリルクロライド 15.8 ml、(R)-4-ベンジルオキサゾリジン-2-オン 11.7 gおよび1.61 N *n*-ブチルリチウム・ヘキサン溶液 45.0 mlを用いて、参考例29(a)に準じて反応および後処理を行うと、無色結晶の目的化合物 18.6 gが得られた。

1) 融点 104.5-105.5°C

(300)

597

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ p p m :

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400 MHz) は次の通りである。

【0677】1.23 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.80-2.91 (2H, m), 3.36 (1H, dd, $J=3.0, 13.5$ Hz), 4.28 (1H, d, $J=3.0, 9.0$ Hz), 4.33 (1H, dd, $J=8.0, 9.0$ Hz), 4.68-4.78 (1H, m), 5.22 (2H, s), 6.91 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.14-7.38 (7H, m)。

(b) (R)-4-ベンジル-3-[(2R, 3S)-3-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-ヒドロキシ-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例30(a)で得られた(R)-4-ベンジル-3-[(4-イソプロピルフェノキシ)アセチル]オキサゾリジン-2-オン 10.0 g、1 Mジブチルボロントリフレート・ジクロロメタン溶液 34.0 ml、トリエチルアミン 5.11 ml および4-ベンジルオキシベンズアルデヒド 6.60 g を用いて、参考例29

(b) に準じて反応および後処理を行うと、フォーム状の目的化合物 12.1 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ p p m :

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0678】1.21 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.73 (1H, dd, $J=9.0, 13.5$ Hz), 2.85 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.02-3.12 (1H, m), 3.53-3.63 (1H, m), 3.93-4.01 (1H, m), 4.21-4.32 (1H, m), 5.02-5.12 (3H, m), 6.18 (1H, d, $J=6.0$ Hz), 6.88-7.46 (18H, m)。

(c) (R)-4-ベンジル-3-[(2R, 3S)-3-ヒドロキシ-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例30(b)で得られた(R)-4-ベンジル-3-[(2R, 3S)-3-(4-ベンジルオキシフェニル)-3-ヒドロキシ-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 9.00 g と5%パラジウム-炭素 1.80 g を用いて、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行うと、フォーム状の目的化合物 7.48 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ p p m :

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0679】1.21 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.75 (1H, dd, $J=9.0, 13.5$ Hz), 2.85 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.05-3.14 (2H, m), 3.70-3.79 (1H, m), 4.01-4.09 (1H, m), 4.26-4.35 (1H, m), 5.04-5.12 (1H, m), 5.34 (1H, brs), 6.18 (1H, d, $J=6.0$ Hz), 6.80 (2H, d, $J=$

598

8.5 Hz), 6.92 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.04-7.37 (9H, m)。

(d) (R)-4-ベンジル-3-[(R)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン

参考例30(c)で得られた(R)-4-ベンジル-3-[(2R, 3S)-3-ヒドロキシ-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 7.00 g およびトリエチルシラン 18.8 ml を用いて、参考例29(d)に準じて反応および後処理を行うと、無色結晶の目的化合物 4.89 g が得られた。

1) 融点 147-148°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ p p m :

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0680】1.19 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.71-2.88 (2H, m), 3.09-3.22 (3H, m), 3.97-4.07 (1H, m), 4.15 (1H, dd, $J=2.5, 7.0$ Hz), 4.47-4.57 (1H, m), 4.88 (1H, s), 6.08 (1H, d, $J=5.5, 8.0$ Hz), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.83 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.05-7.30 (9H, m)。

(e) (R)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例30(d)で得られた(R)-4-ベンジル-3-[(R)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-

(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオニル]オキサゾリジン-2-オン 3.78 g、1 N水酸化リチウム水溶液 20.6 ml および3.1%過酸化水素水 2.26 ml を用いて、参考例29(e)に準じて反応および後処理を行うと、白色粉末の(R)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸 2.18 g が得られた。このカルボン酸 1.95 g、オキサリルクロライド 2.73 ml および2-トリメチルシリルエタノール 4.66 ml を用いて、参考例29(e)に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 2.26 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ p p m :

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0681】0.00 (9H, s), 0.92 (2H, t, $J=8.5$ Hz), 1.18 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 2.81 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.07-3.18 (2H, m), 4.11-4.25 (2H, m), 4.70 (1H, dd, $J=5.5, 7.0$ Hz), 5.75 (1H, s), 6.72 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(301)

599

(f) (R)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例30(e)で得られた(R)-3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル 221mg、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 330mgおよび炭酸カリウム 381mgを用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行

うと、無色油状の目的化合物 264mgが得られた。
1) $[\alpha]_D^{25} + 6.8^\circ$ ($c=0.9$ 、クロロホルム)

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0682】0.00 (9H, s), 0.93 (2H, t, $J=8.5$ Hz), 1.19 (6H, d, $J=7.0$ Hz), 1.45 (9H, s), 2.82 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.10-3.20 (2H, m), 3.43-3.54 (2H, m), 3.98 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.11-4.25 (2H, m), 4.66 (1H, dd, $J=5.5, 7.0$ Hz), 4.91-5.01 (1H, m), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(g) (R)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル

参考例30(f)で得られた(R)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)プロピオン酸2-トリメチルシリルエチル 356mg、4-(2-ピリジル)安息香酸 143mg、シアノリン酸ジエチル 0.11mlおよびトリエチルアミン 0.10mlを用いて、実施例73に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 307mgが得られた。

1) $[\alpha]_D^{25} + 2.8^\circ$ ($c=2.1$ 、クロロホルム)

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (400MHz) は次の通りである。

【0683】0.05 (9H, s), 0.97 (2H, t, $J=8.5$ Hz), 1.18-1.22 (6H, m), 2.85 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.15-3.23 (2H, m), 3.92 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.15-4.30 (4H, m), 4.71 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 6.64-6.74 (1H, m), 6.79 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.89 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.26-7.34 (3H, m), 7.78-7.83 (2H, m), 7.93 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.

600

10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.75 (1H, d, $J=5.0$ Hz)。

参考例31 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)安息香酸

(a) 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)安息香酸メチル

ビスベンゾニトリルジクロロパラジウム 119mgおよび1, 4-ビスジフェニルホスフィノブタン 131mgをトルエン 10mlに懸濁後、室温にて、4-メトキシカルボニルフェニルホウ酸 541mgおよび2-クロロ-5-トリフルオロピリジン 718mgを加え、さらにエタノール 5mlおよび飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 5mlを加え、100℃にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残留物にジイソプロピルエーテルを加えると、白色粉末の目的化合物 (若干の不純物を含む) 841mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0684】3.96 (3H, s), 7.91 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.04 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.12 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.18 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.98 (1H, s)。

(b) 4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)安息香酸

参考例31(a)で得られた6-(3-トリフルオロメチルピリジル)安息香酸メチル 791mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 5.60mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、白色粉末の目的化合物 (若干の不純物を含む) 546mgが得られた。さらに精製することなく実施例106に供した。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0685】8.05 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.29 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.35 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 9.10 (1H, s)。

参考例32 4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸

(a) 4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸メチル

4-メトキシカルボニルフェニルホウ酸 3.24g、2-ブromo-5-ニトロピリジン 4.75gおよびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 1.04gを用い、参考例14(a)に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 3.67gが得られた。1) 融点 197-199℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

(302)

601

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0686】3.97 (3H, s), 7.98 (1H, d, J=8.5 Hz), 8.19 (4H, s), 8.58 (1H, dd, J=2.5, 8.5 Hz), 9.53 (1H, d, J=2.5 Hz)。

(b) 4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸
参考例32(a)で得られた4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸メチル 545mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 3.16mlを用い、実施例2に準じ90℃にて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物370mgが得られた。

1) 融点 262-264℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0687】8.11 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.33 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.36 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.71 (1H, d, J=2.0, 8.0 Hz), 9.48 (1H, d, J=2.0 Hz)。

参考例33 4-(5-メトキシピリジン-2-イル)安息香酸

(a) 4-(5-アミノピリジン-2-イル)安息香酸メチル

参考例32(a)で得られた4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸メチル 1.13gおよび5%パラジウム-炭素 221mgを用い、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物738mgが得られた。

1) 融点 188-189℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0688】3.83 (2H, brs), 3.93 (3H, s), 7.06 (1H, dd, J=3.0, 8.5 Hz), 7.61 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.20 (1H, d, J=3.0 Hz)。

(b) 4-(5-メトキシピリジン-2-イル)安息香酸

参考例33(a)で得られた4-(5-アミノピリジン-2-イル)安息香酸メチル 425mgおよび臭化ナトリウム 383mgを水 10mlに懸濁した。この懸濁液に、0℃にて濃硫酸 0.14mlを加え、80℃にて亜硝酸ナトリウム 295mgを溶解した水 1.5mlを滴下した。同温にて15分間攪拌後、アミド硫酸および濃硫酸 0.21mlを含む水 1.60mlを加え、さらに1.5時間攪拌した。室温にて1時間攪拌後、14時間放置した。反応液に1N水酸化ナトリウムを加えpH8とし、無水酢酸 2.00mlを加

602

え、室温にて30分間攪拌後、反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮し4-(5-アセトキシピリジン-2-イル)安息香酸メチルおよび4-(5-ヒドロキシピリジン-2-イル)安息香酸メチルの混合物が475mgが得られた。得られた混合物および1N水酸化ナトリウム水溶液

2.10mlを用い、実施例2に準じ反応および後処理を行ない、白色粉末のび4-(5-ヒドロキシピリジン-2-イル)安息香酸が得られた。得られたび4-(5-ヒドロキシピリジン-2-イル)安息香酸、55%油状水素化ナトリウム 174mgおよびヨウ化メチル 0.35mlを用い、参考例1(c)に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 429mgが得られた。

1) 融点 130-132℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0689】3.93 (3H, s), 3.94 (3H, s), 7.30 (1H, dd, J=3.0, 9.0 Hz), 7.74 (1H, d, J=9.0 Hz), 8.02 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.12 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.43 (1H, d, J=3.0 Hz)。

(c) 4-(5-メトキシピリジン-2-イル)安息香酸

参考例33(b)で得られた4-(5-メトキシピリジン-2-イル)安息香酸メチル 249mgおよび1N水酸化ナトリウム水溶液 1.20mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物206mgが得られた。

1) 融点 221-223℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム: 重メタノール=3:1の混合溶液中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0690】3.94 (3H, s), 7.35 (1H, dd, J=3.0, 8.5 Hz), 7.75 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.96 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.13 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.38 (1H, d, J=3.0 Hz)。

参考例34) 4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)安息香酸

(a) 4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)安息香酸メチル

参考例32(a)で得られた4-(5-ニトロピリジン-2-イル)安息香酸メチル 519mgをメタノール 25mlおよび2-メトキシエタノール 5mlの混合溶液に懸濁し、室温にて、35%ホルムアルデヒド水溶液 3.20mlおよび5%パラジウム-炭素 64

(303)

603

0 mgを加え、水素雰囲気下、50℃にて3日間攪拌した。触媒を濾去後、濾液を減圧濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。ジイソプロピルエーテルから結晶化することによって、無色結晶の目的化合物 288 mgが得られた。

1) 融点 161-163℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0691】3.05 (6H, s), 3.93 (3H, s), 7.05 (1H, dd, $J=3.0, 8.5$ Hz), 7.66 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 8.00 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.09 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.24 (1H, d, $J=3.0$ Hz)。

(b) 4-(5-ジメチルアミノピリジン-2-イル)

安息香酸

参考例34 (a) で得られた6-(3-ジメチルアミノピリジル) 安息香酸メチル 277 mgおよび1 N水酸化ナトリウム水溶液 2.20 mlを用い、実施例2に準じて反応および後処理を行なうと、無色結晶の目的化合物 237 mgが得られた。

1) 融点 234-236℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重ジメチルスルホキシド中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0692】3.01 (6H, s), 7.18 (1H, dd, $J=3.0, 9.0$ Hz), 7.87 (1H, d, $J=9.0$ Hz), 7.97 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.23 (1H, d, $J=3.0$ Hz)。

参考例35 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メタンスルホニルオキシプロピオン酸エチル 参考例1

(b) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル) 乳酸エチル 3.32 gを無水ジクロロメタン 30 mlに溶解し、この溶液にメタンスルホニルクロライド 0.94 mlを加えた後、氷冷下トリエチルアミン 2.47 mlを滴下した。反応液を室温で3時間攪拌後、反応液を減圧濃縮した。残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。ヘキサンにて結晶化することによって、無色結晶の目的化合物 3.60 gが得られた。

1) 融点 81-83℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシ

604

ラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0693】1.27 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.80 (3H, s), 3.02-3.29 (2H, m), 4.24 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 5.05 (2H, s), 5.05-5.14 (1H, m), 6.93 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.28-7.45 (5H, m)。

(b) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例35 (a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メタンスルホニルオキシプロピオン酸エチル 11.1 gおよびp-クレゾール 2.85 gをN, N-ジメチルホルムアミド 110 mlに溶解した。この溶液に炭酸カリウム 8.09 gを加え、70℃にて16時間攪拌した。この反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=9:1) に付して精製すると、無色油状の目的化合物 2.84 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0694】1.23 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.30 (3H, s), 3.15-3.28 (2H, m), 4.15-4.25 (2H, m), 4.70-4.79 (1H, m), 5.08 (2H, s), 6.78 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.95 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.07 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.26 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.32-7.60 (5H, m)。

(c) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例35 (b) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル 2.84 gと5%パラジウム-炭素 284 mgを用いて、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行うと、シロップ状の目的化合物 2.27 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0695】1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.25 (3H, s), 3.09-3.18 (2H, m), 4.16 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.64-4.72 (1H, m), 4.76 (1H, brs), 6.65-6.79 (4H, m), 7.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.16 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(d) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例35 (c) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-メチルフェノキシ)プロピオン酸エチル 300 mg、2-メタンスルホニルオキシエチル

(304)

605

カルバミン酸-*t*-ブチル 5.98 mg および炭酸カリウム 6.91 mg を用いて、参考例 25 に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 2.61 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0696】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.45 (9H, s), 2.25 (3H, s), 3.12-3.18 (2H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 3.99 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 4.96 (1H, brs), 6.72 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.02 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例 36 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例 1 (b) で得られた 3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル 5.00 g、4-*t*-ブチルフェノール 2.50 g、トリフェニルホスフィン 5.24 g をおよび 40% ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 8.80 ml を用いて、実施例 122 に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 3.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0697】1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.26 (9H, s), 3.12-3.21 (2H, m), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.70 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 5.04 (2H, s), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.90 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.20-7.26 (4H, m), 7.31-7.45 (5H, m)。

(b) 2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル

参考例 36 (a) で得られた 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)プロピオン酸エチル 3.00 g と 5% パラジウム-炭素 3.00 mg を用いて、参考例 1 (d) に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 2.37 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0698】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.26 (9H, s), 3.13-3.20 (2H, m), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.69 (1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 4.81 (1H, brs), 6.75 (2H,

606

d, $J=8.5$ Hz), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例 36 (b) で得られた 2-(4-*t*-ブチルフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル 2.37 g、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 3.60 g および炭酸カリウム 4.78 g を用いて、参考例 25 に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 3.13 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0699】1.21 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.26 (9H, s), 1.45 (9H, s), 3.13-3.19 (2H, m), 3.51 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.99 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.66-4.72 (1H, m), 4.90-5.02 (1H, m), 6.76 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.82 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.22 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例 37 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例 1 (b) で得られた 3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル 10.0 g、4-フルオロフェノール 4.15 g、トリフェニルホスフィン 10.6 g をおよび ジエチルアゾジカルボキシレート 6.40 ml を用いて、実施例 122 に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 7.00 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準に TMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0700】1.18 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.16 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 4.16 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.66 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 5.04 (2H, s), 6.72-6.80 (2H, m), 6.89-6.97 (4H, m), 7.21 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.31-7.48 (5H, m)。

(b) 2-(4-フルオロフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル 参考例 37

(a) で得られた 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル 7.00 g を 25% 臭化水素・酢酸溶液 70 ml に溶解し、室温にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残留物をエタノール 70 ml に溶解し、この溶液に炭酸カリウム 6.90 g を加え、室温にて

(305)

607

4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝9：1～4：1）にて精製すると、白色粉末の目的化合物 2. 75 g が得られた。

1) 融点 80-81℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0701】1.19 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.15 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 4.17 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.65 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 4.76 (1H, s), 6.71-6.80 (4H, m), 6.87-6.95 (2H, m), 7.16 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(c) 2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-(2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例37(b)で得られた2-(4-フルオロフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル 2. 75 g、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン 2. 08 gおよび炭酸カリウム 3. 75 gを用いて、参考例3(e)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 3. 75 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0702】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.48-1.90 (6H, m), 3.16 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.49-3.57 (1H, m), 3.77-3.95 (2H, m), 4.00-4.21 (5H, m), 4.60-4.73 (2H, m), 6.74-6.79 (2H, m), 6.84-6.95 (4H, m), 7.20 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(d) 2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例37(c)で得られた2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル 3. 75 gおよびp-トルエンスルホン酸一水和物 2. 15 gを用いて、参考例3(f)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 2. 68 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0703】1.25 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.06 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 3.20-3.23 (2H, m), 3.98-4.02 (2H, m),

608

4.10-4.13 (2H, m), 4.22 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.71 (1H, dd, $J=6.0, 7.0$ Hz), 6.80-7.00 (6H, m), 7.25-7.28 (2H, m)。

(e) 2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル

参考例37(d)で得られた2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 2. 68 g、トリエチルアミン 1. 61 mlおよびメタンスルホニルクロライド 0. 65 mlを用いて、参考例3(g)に準じて反応および後処理を行なうと、薄黄色油状の目的化合物 3. 17 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0704】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.08 (3H, s), 3.17 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 4.18 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.20-4.24 (2H, m), 4.54-4.58 (2H, m), 4.66 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.74-6.96 (6H, m), 7.23 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

(f) 3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例37(e)で得られた2-(4-フルオロフェノキシ)-3-[4-(2-メタンスルホニルオキシエトキシ)フェニル]プロピオン酸エチル 3. 16 gおよびアジ化ナトリウム 1. 45 gを用いて、参考例3

(h)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 2. 67 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

【0705】1.20 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.17 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.58 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.08-4.23 (4H, m), 4.66 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 6.74-6.96 (6H, m), 7.20-7.25 (2H, m)。

(g) 3-[4-(2-アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例37(f)で得られた3-[4-(2-アジドエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸エチル 2. 60 gと5%パラジウム-炭素 250 mgを用い、参考例1(d)に準じて反応および後処理を行なうと、無色油状の目的化合物 2. 30 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル： δ ppm：

重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル（270MHz）は次の通りである。

(306)

609

【0706】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.99-3.15 (2H, m), 3.16 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.97 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.17 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.66 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.72-6.96 (6H, m), 7.1-7.27 (2H, m)。

参考例38 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-クロロフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-クロロフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例35 (a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メタンスルホニルオキシプロピオン酸エチル 8.82 g および4-クロロフェノール 3.00 g および炭酸カリウム 6.44 g を用いて、参考例35 (b) に準じて反応および後処理を行うと、無色結晶の目的化合物 5.99 g が得られた。

1) 融点 63-64℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0707】1.18 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 4.16 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.69 (1H, t, J=6.5 Hz), 5.04 (2H, s), 6.75 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13-7.23 (4H, m), 7.25-7.55 (5H, m)。

(b) 2-(4-クロロフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル

参考例38 (a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-クロロフェノキシ)プロピオン酸エチル 5.99 g、25%臭化水素酢酸溶液 60 ml および炭酸カリウム 4.68 g を用いて、参考例37 (b) に準じて反応および後処理を行うと、無色結晶の目的化合物 3.85 g が得られた。

1) 融点 90-93℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0708】1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.16 (2H, d, J=6.5 Hz), 4.17 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.69 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.95 (1H, brs), 6.76 (4H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.18 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-クロロフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例38 (b) で得られた2-(4-クロロフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル 1.01 g、2-ヒドロキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチルエステル 1.27 g、トリフェニルホスフィン 2.06 g およびジエチルアゾジカルボキシ

610

レート 1.37 g を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 1.14 g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0709】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.45 (9H, s), 3.17 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.43-3.57 (2H, m), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.17 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.69 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.96 (1H, brs), 6.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.10-7.20 (4H, m)。

参考例39 2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

(a) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸エチル

4-ヒドロキシフェニル乳酸エチル 224 mg、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 638 mg および炭酸カリウム 737 mg を用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 205 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0710】1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.45 (9H, s), 2.72 (1H, d, J=6.0 Hz), 2.91 (1H, dd, J=6.5, 14.0 Hz), 3.07 (1H, dd, J=4.5, 14.0 Hz), 3.52 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.39 (1H, ddd, J=4.5, 6.0, 6.5 Hz), 4.98 (1H, brt), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(b) 2-ヒドロキシ-3-[4-[2-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]エトキシ]フェニル]プロピオン酸エチル

参考例39 (a) で得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸エチル 168 mg、4-(2-ピリジル)ベンゾイルクロライド・塩酸塩 126 mg およびトリエチルアミン 0.28 ml を用いて、実施例126に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 188 mg が得られた。

1) 融点 97-99℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

(307)

611

【0711】1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 2.92 (1H, d, J=6.5, 14.0 Hz), 3.07 (1H, dd, J=4.5, 14.0 Hz), 3.90 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.16 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.39 (1H, dd, J=4.5, 6.5 Hz), 6.66 (1H, brt), 6.87 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.27-7.32 (1H, m), 7.73-7.84 (2H, m), 7.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.07 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.73 (1H, d, J=5.0 Hz)。

参考例40 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例1 (b) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル4.50 g、4-トリフルオロメトキシフェノール 2.33 ml、トリフェニルホスフィン 4.71 gをおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 8.15 mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 4.19 gが得られた。

1) 融点 34-36℃

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0712】1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.18 (2H, d, J=6.5 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.70 (1H, t, J=6.5 Hz), 5.04 (2H, s), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.29-7.46 (5H, m)。

(b) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例40 (a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル 4.08 g、25%臭化水素・酢酸溶液 40 mlおよび炭酸カリウム 1.68 gを用いて、参考例37 (b) に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 2.98 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0713】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.50 (1H, brs), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.70 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(c) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ

612

エトキシ)フェニル]-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例40 (b) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピオン酸エチル 2.93 g、2-メタンスルホンオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 4.73 gおよび炭酸カリウム 5.46 gを用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 2.28 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0714】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.44 (9H, s), 3.18 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.51 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.70 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.97 (1H, brt), 6.81 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例41 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-シアノフェノキシ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-シアノフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例1 (b) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)乳酸エチル1.01 g、4-シアノフェノール 481 mg、トリフェニルホスフィン 1.06 gをおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.73 mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 619 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0715】1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.21 (2H, d, J=6.5 Hz), 4.17 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (1H, t, J=6.5 Hz), 5.04 (2H, s), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.28-7.48 (5H, m), 7.54 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(b) 2-(4-シアノフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル

参考例41 (a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(4-シアノフェノキシ)プロピオン酸エチル 376 mgと5%パラジウム-炭素65 mgを用いて、参考例1 (d) に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 293 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシ

(308)

613

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0716】 1.19 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.19 (2H, d, J=6.5 Hz), 4.18 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.78 (1H, t, J=6.5 Hz), 6.76 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.88 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.14 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.62 (2H, d, J=9.0 Hz)。

(c) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-シアノフェノキシ)プロピオン酸エチル

参考例41(b)で得られた2-(4-シアノフェノキシ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル 293mg、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 560mgおよび炭酸カリウム 520mgを用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 245mgが得られた。

1) 融点 97-99℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0717】 1.20 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.45 (9H, s), 3.21 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.52 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.19 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.79 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.97 (1H, brt), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.55 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例4-2 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メチルチオフェノキシ)プロピオン酸メチル

参考例39(a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 389mg、4-メチルチオフェノール 241mg、トリフェニルホスフィン 463mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.31mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 (若干の不純物を含む) 265mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0718】 1.45 (9H, s), 2.43 (3H, s), 3.17 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.52 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.72 (3H, s), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.72 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.98 (1H, brt), 6.78 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.82 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.20 (4H, d, J=8.5 Hz)。

参考例43 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニル

614

アミノエトキシ)フェニル]-2-(4-メタンスルホニルフェノキシ)プロピオン酸メチル

参考例39(a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 518mg、4-メタンスルホニルフェノール 394mg、トリフェニルホスフィンの代わりにトリブチルホスフィン 0.57ml、およびジエチルアゾジカルボキシレートの代わりに1, 1'- (アゾジカルボニル) ジピペリジン

578mgを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、フォーム状固体の目的化合物 441mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0719】 1.44 (9H, s), 3.00 (3H, s), 3.22 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.51 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.74 (3H, s), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.84 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.97 (1H, brt), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (2H, d, J=9.0 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (2H, d, J=9.0 Hz)。

参考例44 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-フルオロフェノキシ)プロピオン酸メチル

参考例39(a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 420mg、4-フルオロフェノール 284mg、トリフェニルホスフィン 666mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 1.10mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 314mgが得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0720】 1.45 (9H, s), 3.16 (2H, d, J=6.5 Hz), 3.52 (2H, q, J=5.0 Hz), 3.72 (3H, s), 3.99 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.67 (1H, t, J=6.5 Hz), 4.96 (1H, brt), 6.76 (2H, dd, J=4.0, 9.0 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (2H, dd, J=8.0, 9.0 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例45 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル

参考例9(b)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(4-イソプロピルフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 4.85g、2-メタンスルホニルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 8.47

(309)

615

gおよび炭酸カリウム 9.78 gを用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色油状の目的化合物 6.23 gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0721】1.15-1.28 (9H, m), 1.37 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.83 (1H, septet, $J=7.0$ Hz), 3.10 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.25 (1H, d, $J=13.5$ Hz), 3.46-3.58 (2H, m), 4.00 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.21 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.95-5.05 (1H, m), 6.75 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 6.81 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.06 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

参考例46 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェニルチオプロピオン酸メチル

参考例39 (a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 366 mg、チオフェノール 0.17 ml、トリフェニルホスフィン 438 mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.29 mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物209 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0722】1.45 (9H, s), 3.00 (1H, dd, $J=6.5$, 13.5 Hz), 3.13 (1H, dd, $J=9.5$, 13.5 Hz), 3.52 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 3.58 (3H, s), 3.86 (1H, dd, $J=6.5$, 9.5 Hz), 3.98 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 5.00 (1H, brt), 6.80 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.10 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.30-7.40 (3H, m), 7.41-7.56 (2H, m)。

参考例47 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-(ピリジン-3-イルオキシ)プロピオン酸メチル

参考例39 (a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 404 mg、3-ヒドロキシピリジン 227 mg、トリフェニルホスフィン 938 mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.65 mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 345 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

616

【0723】1.44 (9H, s), 3.21 (2H, d, $J=6.5$ Hz), 3.52 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.74 (3H, s), 3.99 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.78 (1H, t, $J=6.5$ Hz), 4.96 (1H, brt), 6.84 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.11 (1H, d, $J=8.5$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J=5.0$, 8.5 Hz), 7.20 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 8.23 (1H, d, $J=5.0$ Hz), 8.24 (1H, s)。

参考例48 2-(ベンズオキサゾール-2-イルチオ)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸メチル

参考例39 (a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 415 mg、2-メルカプトベンズオキサゾール 277 mg、トリフェニルホスフィンの代わりにトリブチルホスフィン 0.46 ml、およびジエチルアゾジカルボキシレートの代わりに1, 1'- (アゾジカルボニル) ジピペリジン 460 mgを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物(若干の不純物を含む) 665 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0724】1.46 (9H, s), 3.26 (1H, dd, $J=7.0$, 14.0 Hz), 3.35 (1H, dd, $J=7.5$, 14.0 Hz), 3.51 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.71 (3H, s), 3.96 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.76 (1H, dd, $J=7.0$, 7.5 Hz), 4.89 (1H, brt), 6.81 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.17 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.22-7.29 (2H, m), 7.43 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.60 (1H, d, $J=6.0$ Hz)。

参考例49 2-(ベンズオキシ)-3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]プロピオン酸メチル

参考例39 (a)と同様にして得られた3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-ヒドロキシプロピオン酸メチル 398 mg、ベンズブロミド 0.28 ml、55%油状水素化168 mgおよびよう化テトラブチルアンモニウム 43 mgを用いて、参考例1 (c)に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 133 mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0725】1.46 (9H, s), 2.99 (1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.00 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 3.53 (2H, q, $J=5.0$ Hz), 3.71 (3H, s), 4.00 (2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.09 (1H, d, $J=5.5$, 7.5 Hz), 4.37 (1H, d, $J=12.0$ Hz), 4.65 (1H, d, $J=12.0$ Hz), 5.00 (1H, brt), 6.81 (2H, d,

(310)

617

J=8.5 Hz), 7.13 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.17-7.22 (2H, m), 7.25-7.31 (3H, m)。

参考例50 2-(3-フェニルプロピル)-2-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジル]マロン酸ジベンジル

(a) 4-(3-ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル)ベンジルアルコール

水素化リチウムアルミニウム 4.00 g をテトラヒドロフラン 180 ml に懸濁し、氷冷下、4-(2-シアノエチル)安息香酸メチル 10.0 g を溶解したテトラヒドロフラン溶液 80 ml を滴下した後、混合液を室温で1時間、60℃で3時間攪拌した。反応液に水 4 ml、15%水酸化ナトリウム水溶液 4 ml、水 12 ml を順次加え、1時間攪拌後、不溶物を濾去し、濾取物をテトラヒドロフランで洗浄した。濾液と洗浄液を合せ、N-ベンジルオキシカルボニル-5-ノルボルネン-2,3-ジカルボキシイミド 16.5 g を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を濃縮し、残留物を酢酸エチルと水に溶かした後、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。抽出液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=1：1）に付して精製すると、結晶性の目的化合物 5.67 g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル：δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0 7 2 6】1.82 (2H, quintuplet, J=7.5 Hz), 2.64 (2H, t, J=7.5 Hz), 3.22 (2H, dt, J=6.5, 7.5 Hz), 4.65 (2H, s), 4.75 (1H, brs), 5.09 (2H, s), 7.16 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.26-7.36 (7H, m)。

(b) 4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジルアルコール

参考例50 (a) で得られた4-(3-ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル)ベンジルアルコール 1.00 g のエタノール 20 ml 溶液に5%パラジウム炭素 0.15 g を加え、水素雰囲気中、室温で2時間攪拌した。触媒を濾去し、濾液を濃縮してガム状の4-(3-アミノプロピル)ベンジルアルコールを得た。得られた4-(3-アミノプロピル)ベンジルアルコール、4-(2-ピリジル)安息香酸 668 mg およびカルボニルジイミダゾール 650 mg を用いて、実施例5に準じて反応および後処理を行い、無色結晶の目的化合物 0.74 g が得られた。

1) 融点 118-120℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル：δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

618

【0 7 2 7】2.00 (2H, quintuplet, J=7.5 Hz), 2.75 (2H, t, J=7.5 Hz), 3.53 (2H, dt, J=6.5, 7.5 Hz), 4.65 (2H, s), 6.10 (1H, brs), 7.20-7.31 (5H, m), 7.72-7.80 (4H, m), 8.02 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71 (1H, d, J=5.0 Hz)。

(c) 4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジルクロライド

参考例50 (b) で得られた4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジルアルコール 0.74 g のジクロロメタン 20 ml 溶液にメタンスルホンクロライド 294 mg およびトリエチルアミン 0.37 ml を順次加え、室温で16時間放置した。反応液を濃縮し、残留物を酢酸エチルと水を加えた後、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。抽出液を濃縮すると結晶性の残留物が得られた。これを少量のジイソプロピルエーテルで洗浄して目的化合物 0.68 g が得られた。

1) 融点 115-117℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル：δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0 7 2 8】1.99 (2H, quintuplet, J=7.5 Hz), 2.75 (2H, t, J=7.5 Hz), 3.53 (2H, dt, J=6.5, 7.5 Hz), 6.15 (1H, brs), 7.21-7.34 (5H, m), 7.76-7.82 (4H, m), 8.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.70-8.73 (1H, m)。

(d) 2-(3-フェニルプロピル)-2-[4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジル]マロン酸ジベンジル

参考例50 (c) で得られた4-[3-[4-(2-ピリジル)ベンゾイルアミノ]プロピル]ベンジルクロライド 488 mg、5%油性水素化ナトリウム 64 mg および(3-フェニルプロピル)マロン酸ジベンジル 540 mg を用い、参考例2 (a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.65 g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル：δ ppm：重クロロホルム中、内部標準にTMS（テトラメチルシラン）を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル（270 MHz）は次の通りである。

【0 7 2 9】1.44-1.58 (2H, m), 1.78-1.87 (2H, m), 1.92 (2H, t, J=7.5 Hz), 2.52 (2H, t, J=7.5 Hz), 2.65 (2H, t, J=7.5 Hz), 3.19 (2H, s), 3.49 (2H, d, J=6.0, 7.5 Hz), 5.05 (1H, d, J=12.0 Hz), 5.09 (1H, d, J=12.0 Hz), 6.16 (1H, brt, J=6.0 Hz), 6.78 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.96 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.05 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.17-7.35 (14H, m), 7.76-7.82 (4H, m), 8.06 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.71 (1H, d, J=5.0 Hz)。

(311)

619

参考例51 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)-3-クロロフェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

(a) 3-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例4(c)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1. 43gをジエチルエーテル 20mlに溶解し、室温下スルフルクロライド 0.71mlを溶解したジエチルエーテル溶液 5.0mlを滴下し、8時間攪拌後、一晩放置した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:3)にて精製し、無色油状の目的化合物 1.09gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0730】1.20(3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.15(1H, d, $J=5.0$ Hz), 3.16(1H, d, $J=7.5$ Hz), 4.19(2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.73(1H, dd, $J=5.0, 7.5$ Hz), 5.49(1H, s), 6.84(2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.94(1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.96(1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.12(1H, dd, $J=2.0, 8.5$ Hz), 7.25(2H, t, $J=8.0$ Hz), 7.28(1H, d, $J=2.0$ Hz)。

(b) 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)-3-クロロフェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例51(a)で得られた3-(3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル 761mg、2-ヒドロキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチルエステル 0.96g、トリフェニルホスフィン 1.55gおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 2.69mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 1.03gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0731】1.21(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.45(9H, s), 3.15(1H, d, $J=5.5$ Hz), 3.16(1H, d, $J=7.5$ Hz), 3.56(2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.05(2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.19(2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.73(1H, dd, $J=5.5, 7.5$ Hz), 5.06(1H, brt), 6.84(2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.85(1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.96(1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.15(1H, dd, $J=2.0, 8.5$ Hz), 7.25(2H, t, $J=8.0$ Hz), 7.33(1H, d, $J=2.0$ Hz)。

620

参考例52 3-[3-ブromo-4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

(a) 3-(3-ブromo-4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例4(c)で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.43gをクロロホルム 20mlに溶解し、室温下、*N*-ブromoこはく酸イミド 1.12gを加え、70℃にて4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残留物に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて精製し、無色油状の目的化合物 1.41gが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0732】1.20(3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.148(1H, d, $J=5.5$ Hz), 3.153(1H, d, $J=7.0$ Hz), 4.18(2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.72(1H, dd, $J=5.5, 7.0$ Hz), 5.45(1H, brs), 6.84(2H, d, $J=8.0$ Hz), 6.94(1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.96(1H, t, $J=8.0$ Hz), 7.16(1H, dd, $J=2.0, 8.5$ Hz), 7.25(2H, t, $J=8.0$ Hz), 7.42(1H, d, $J=2.0$ Hz)。

(b) 3-[3-ブromo-4-(2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ)フェニル]-2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例52(a)で得られた3-(3-ブromo-4-ヒドロキシフェニル)-2-フェノキシプロピオン酸エチル 374mg、2-ヒドロキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチルエステル 403mg、トリフェニルホスフィン 672mgおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 1.16mlを用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 466mgが得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS(テトラメチルシラン)を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル(270MHz)は次の通りである。

【0733】1.21(3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.45(9H, s), 3.15(1H, d, $J=5.5$ Hz), 3.16(1H, d, $J=7.0$ Hz), 3.56(2H, q, $J=5.0$ Hz), 4.04(2H, t, $J=5.0$ Hz), 4.19(2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.72(1H, dd, $J=5.5, 7.0$ Hz), 5.08(1H, brt), 6.82(1H, d, $J=8.5$ Hz), 6.85(1H, d, $J=8.0$ Hz), 6.96(1H, t, $J=7.5$ Hz), 7.20(1H, dd, $J=2.0, 8.5$ Hz), 7.25(2H, dd, $J=7.5, 8.0$ Hz), 7.50(1H, d, $J=2.0$ Hz)。

参考例53 3-[4-(2-*t*-ブトキシカルボニル

(312)

621

アミノエトキシ] - 3-ニトロフェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル

(a) 3- (4-ヒドロキシ-3-ニトロフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例4 (c) で得られた3- (4-ヒドロキシフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 1.00 g をジクロロメタン 4.0 ml およびジエチルエーテル

8.0 ml の混合溶液に溶解し、室温下、水 2.5 ml、濃塩酸 1.17 ml および硝酸ナトリウム 2.97 mg を加え、室温にて2.5時間攪拌後、14時間放置した。反応液に酢酸エチルと水を加え、酢酸エチル層を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 4: 1) にて精製し、無色油状の目的化合物 93.5 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0734】1.23 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.23 (2H, d, J=6.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.76 (1H, t, J=6.0 Hz), 6.83 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.97 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.11 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.25 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.56 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 8.08 (1H, d, J=2.0 Hz)。

(b) 3- [4- (2-*t*-ブトキシカルボニルアミノエトキシ) - 3-ニトロフェニル] - 2-フェノキシプロピオン酸エチル

参考例53 (a) で得られた3- (4-ヒドロキシ-3-ニトロフェニル) - 2-フェノキシプロピオン酸エチル 270 mg、2-ヒドロキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチルエステル 322 mg、トリフェニルホスフィン 535 mg をおよび40%ジエチルアゾジカルボキシレート・トルエン溶液 0.93 ml を用いて、実施例122に準じて反応および後処理を行い、無色油状の目的化合物 349 mg が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm: 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0735】1.23 (3H, t, J=7.0 Hz), 1.44 (9H, s), 3.23 (2H, d, J=6.0 Hz), 3.57 (2H, q, J=5.0 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.21 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.76 (1H, t, J=6.0 Hz), 5.14 (1H, brt), 6.83 (2H, d, J=8.0 Hz), 6.97 (1H, t, J=7.5 Hz), 7.00 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.25 (2H, dd, J=7.5, 8.0 Hz), 7.50 (1H, dd, J=2.0, 8.5 Hz), 7.85 (1H, d, J=2.0 Hz)。

参考例54 (S) - 2-ベンジルオキシカルボニルアミノ-3- [4- (2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ

622

エトキシ] フェニル] プロピオン酸メチル

N-ベンジルオキシカルボニル-L-チロシンメチルエステル 4.94 g、2-メタンスルホンルオキシエチルカルバミン酸-*t*-ブチル 8.97 g および炭酸カリウム 10.4 g を用いて、参考例25に準じて反応および後処理を行うと、無色結晶の目的化合物 3.32 g が得られた。

1) 融点 89-91°C

2) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

10 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0736】1.62 (9H, s), 3.00-3.10 (2H, m), 3.48-3.56 (2H, m), 3.72 (3H, s), 3.98 (2H, t, J=5.0 Hz), 4.56-4.68 (1H, m), 4.99 (1H, brs), 5.10 (2H, ABq, J=12.5 Hz, Δ =0.03 ppm), 5.15-5.24 (1H, m), 6.79 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.00 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.23-7.41 (5H, m)。

参考例55 3- (4-ヒドロキシフェニル) - 2- (フェニルアミノ) プロピオン酸エチル

20 (a) 3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2- (フェニルアミノ) プロピオン酸エチル

3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2-メタンスルホンルオキシプロピオン酸エチル 4.00 g とアニリン 5 ml 混合物を110°Cで24時間攪拌後、反応物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: ヘキサン=1: 4) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 3.94 g が得られた。

1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

30 重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した ^1H -核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0737】1.17 (3H, t, J=7 Hz), 3.00-3.14 (2H, m), 4.12 (2H, d, q, J=1.5, 7 Hz), 4.30 (1H, t, J=6 Hz), 5.04 (2H, s), 6.60 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.73 (1H, t, J=7.5 Hz), 6.89 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.16 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.31-7.44 (5H, m)。

(b) 3- (4-ヒドロキシフェニル) - 2- (フェニルアミノ) プロピオン酸エチル

参考例55 (a) で得られた3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2- (フェニルアミノ) プロピオン酸エチル 3.94 g、エタノール 40 ml およびテトラヒドロフラン 20 ml の混合溶液に、5%パラジウム-炭素 0.80 g を加え、水素圧常圧で50°Cで6時間攪拌した。反応混合物より触媒を濾去した後、溶剤を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: ヘキサン=1: 2) に付すと、シロップ状の目的化合物 2.95 g が得られた。

50 1) ^1H -核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

(313)

623

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0738】 1.19 (3H, t, J=7 Hz), 3.00-3.13 (2H, m), 4.13 (2H, d, q, J=1, 7 Hz), 4.30 (1H, brt, J=6 Hz), 4.88 (1H, brs), 6.60 (2H, d, J=8 Hz), 6.71-6.76 (3H, m), 7.03 (2H, d, J=8 Hz), 7.14-7.20 (2H, m)。

参考例56 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)プロピオン酸エチル
3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-メタンスルホンオキシプロピオン酸エチル 4.50g と N-エチルアニリン 5.6ml を用い、参考例55(a) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物と N-エチルアニリンの混合物 6.30g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0739】 1.07 (3H, t, 3H, J=7 Hz), 1.14 (3H, t, J=7 Hz), 3.01-3.45 (4H, m), 4.09 (2H, q, J=7 Hz), 4.39 (1H, t, J=7.5 Hz), 5.02 (2H, s), 6.66-6.75 (3H, m), 6.87 (2H, d, J=8 Hz), 7.10 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.15-7.25 (2H, m), 7.31-7.44 (5H, m)。

(b) 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル

参考例56(a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)プロピオン酸エチルと N-エチルアニリンの混合物

6.30g を用い、参考例55(b) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 2.37g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0740】 1.07 (3H, t, J=7 Hz), 1.15 (3H, t, J=7 Hz), 3.05 (1H, d, d, J=8, 14 Hz), 3.26 (1H, d, J=7.5, 14 Hz), 3.30-3.46 (2H, m), 4.10 (2H, q, J=7 Hz), 4.38 (1H, t, J=8 Hz), 4.75 (1H, br. s), 6.67-6.79 (5H, m), 7.05 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.18-7.26 (2H, m)。

参考例57 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(ピロール-1-イル)プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(ピロール-1-イル)プロピオン酸エチル

624

3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-アミノプロピオン酸エチル 3.30g のジクロロメタン 80ml 溶液に1, 4-ジクロロ-1, 4-ジメトキシブタン

3.30g を加え、更にアンバーリストA-21 20g を加え室温で18時間攪拌した。反応終了後、反応液をろ過した。ろ液を濃縮し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン=1:5) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 1.00g が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0741】 1.19 (3H, t, J=7 Hz), 3.19 (1H, d, d, J=8.5, 14 Hz), 3.34 (1H, d, d, J=7, 14 Hz), 4.14 (2H, q, J=7 Hz), 4.68 (1H, d, d, J=7, 8.5 Hz), 5.01 (2H, s), 6.15 (2H, t, J=2 Hz), 6.73 (2H, t, J=2 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.28-7.43 (5H, m)。

(b) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-(ピロール-1-イル)プロピオン酸エチル

参考例57(a) で得られた3-(4-ベンジルオキシフェニル)-2-(ピロール-1-イル)プロピオン酸エチル 1.00g と5%パラジウム-炭素 0.12g を用い、参考例55(b) に準じて反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 0.71g が得られた。1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270MHz) は次の通りである。

【0742】 1.20 (3H, t, J=7 Hz), 3.18 (1H, d, d, J=8.5, 14 Hz), 3.33 (1H, d, d, J=7, 14 Hz), 4.15 (2H, q, J=7 Hz), 4.67 (1H, d, d, J=7, 8.5 Hz), 4.80 (1H, s), 6.14 (2H, t, J=2 Hz), 6.71 (2H, d, J=8.5 Hz), 6.72 (2H, d, J=2 Hz), 6.88 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例58 2-(N,N-ジエチルアミノ)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸エチル

DL-チロシンエチルエステル塩酸塩 491mg のメタノール 5ml 溶液に酢酸 0.3ml およびアセトアルデヒド 0.5ml を加え、氷冷下でシアノ水素化硼素ナトリウム 126mg を加え、2時間室温で攪拌した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物を酢酸エチルおよび水に溶解し、次いで酢酸エチル層を分離した。抽出液を重曹水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール:ジクロロメタン=1:20) に付して精製すると、シロップ状の目的化合物 420mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:
重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシ

(314)

625

ラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0743】 1.02 (6H, t, J=7 Hz), 1.16 (3H, t, J=7 Hz), 2.53 (2H, sextet, J=7 Hz), 2.79 (2H, sextet, J=7 Hz), 2.81 (1H, d, d, J=6, 13.5 Hz), 2.99 (1H, d, d, J=9, 13.5 Hz), 3.55 (1H, d, d, J=6, 9 Hz), 4.02-4.11 (2H, m), 6.72 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.02 (2H, d, J=8.5 Hz)。

参考例59 2-N-(t-ブトキシカルボニル) エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル

(a) 2-エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル

DL-チロシンエチルエステル塩酸塩 983 mg、アセトアルデヒド 0.26 ml およびシアノ水素化硼素ナトリウム 100 mg を用い、参考例9に準じて、反応および後処理を行なうと、シロップ状の目的化合物 515 mg が得られた。これは放置すると結晶化した。

1) 融点 87-89℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0744】 1.08 (3H, t, J=7 Hz), 1.18 (3H, t, J=7 Hz), 2.48-2.72 (2H, m), 2.82-2.96 (2H, m), 3.50 (1H, t, J=7 Hz), 4.11 (2H, q, J=7 Hz), 6.68 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.5 Hz)。

(b) 2-N-(t-ブトキシカルボニル) エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル

参考例59 (a) で得られる2-エチルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル 569 mg、ジ-t-ブチルジカーボネート 785 mg およびジクロロメタン 10 ml の溶液に、氷冷下でトリアエチルアミン 1 ml を滴下した後、室温で4時間攪拌した。反応終了後、反応液を濃縮し、得られた残留物を酢酸エチルと水に溶解し、次いで酢酸エチル層を分離した。得られた抽出溶液を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル-ヘキサン=1:2) に付すと、シロップ状の目的化合物 663 mg が得られた。

1) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0745】 0.90 (3H, br t, J=7 Hz), 1.21-1.31 (3H, m), 1.45 (9H, s), 3.15-3.37 (1H, m), 3.08 (1H, d, d, J=10, 14 Hz), 3.15-3.37 (1H, m), 3.24 (1H, d, J=5, 14 Hz), 3.85-4.30 (3H, m), 6.76 (2H, br d,

626

J=8.5 Hz), 7.00-7.11 (2H, m)。

参考例60 2-N-(t-ブトキシカルボニル) プロピルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル

(a) 3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-プロピルアミノプロピオン酸エチル

DL-チロシンエチルエステル塩酸塩、プロピオンアルデヒドおよびシアノ水素化硼素ナトリウムを用い、参考例59 (a) に準じて、反応および後処理を行なうと、目的化合物が得られる。

(b) 2-N-(t-ブトキシカルボニル) プロピルアミノ-3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピオン酸エチル

参考例60 (a) で得られた3-(4-ヒドロキシフェニル)-2-プロピルアミノプロピオン酸エチルとt-ブチルジカーボネートを用い、参考例59 (b) に準じて、反応および後処理を行なうと、目的化合物が得られる。

参考例61 2-[4-(2-ピリジル) ベンゾイルアミノ] エタノール

4-(2-ピリジル) ベンゾイルクロライド塩酸塩 254 mg のジクロロメタン 2 ml 懸濁液にトリエチルアミン 0.14 ml を加え、これに氷冷下、攪拌しながらエタノールアミン 0.060 ml のジクロロメタン 3 ml 溶液を滴下した。混合液を30分攪拌した後、反応液を濃縮し、残留物を酢酸エチルと水に溶かし、酢酸エチル層を分離した。抽出液を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して得られる結晶性残留物をイソプロピルエーテルで洗浄して目的化合物 111 mg が得られた。

1) 融点 86-88℃

2) ¹H-核磁気共鳴スペクトル: δ ppm:

重クロロホルム中、内部標準にTMS (テトラメチルシラン) を使用して測定した¹H-核磁気共鳴スペクトル (270 MHz) は次の通りである。

【0746】 2.52 (1H, t, J=4.5 Hz), 3.68 (2H, dt, J=5.0, 5.5 Hz), 3.88 (2H, dt, J=4.5, 5.5 Hz), 6.68 (1H, br s), 7.24-7.33 (1H, m), 7.77-7.82 (1H, m), 7.90 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.09 (2H, d, J=8.5 Hz), 8.72 (1H, d, J=5 Hz)

【0747】

【試験例】 血糖降下作用 (方法1)

体重40 g 以上で高血糖状態を示す雄性KKマウスに、各化合物0.01% (約10 mg/kg/day) の割合で粉末飼料F-2 (船橋農場) に混ぜて3日間投与した。別に、粉末飼料のみを与えたマウスを対照群とした。次いで無麻酔下で尾静脈より採血し、遠心分離により得られた血漿中の血糖値をグルコローダーF (A&T社製) にて測定した。

【0748】 血糖降下率は次の式より求めた。

(315)

627

628

【0749】血糖降下率(%) = [(対照群血糖値 - 化合物投与群血糖値) / 対照群血糖値] × 100 * 【0750】
 得られた結果を表156に示す。 * 【表156】

試験化合物	血糖降下率 (%)
実施例2の化合物	43
実施例4の化合物	15
実施例8の化合物	22
実施例10の化合物	64
実施例12の化合物	42
実施例16の化合物	64
実施例18の化合物	68
実施例22の化合物	17
実施例27の化合物	35
実施例29の化合物	20
実施例30の化合物	18
実施例32の化合物	21
実施例34の化合物	22
実施例43の化合物	20
実施例48の化合物	37
実施例52の化合物	20
実施例62の化合物	16
実施例70の化合物	23
実施例74の化合物	60
実施例76の化合物	50
実施例78の化合物	53
実施例80の化合物	50
実施例82の化合物	32
実施例97の化合物	66
実施例99の化合物	57
実施例101の化合物	51
実施例103の化合物	48
実施例104の化合物	73
実施例107の化合物	38
実施例109の化合物	38
実施例111の化合物	70
実施例113の化合物	64
実施例115の化合物	66
実施例117の化合物	70
実施例119の化合物	49
実施例121の化合物	60
実施例123の化合物	43
実施例125の化合物	54
実施例127の化合物	56
実施例137の化合物	49
実施例139の化合物	23
実施例141の化合物	27
実施例143の化合物	43
実施例145の化合物	28

(316)

629
実施例152の化合物

58

630

表156から、本発明の化合物は優れた血糖降下作用を示した。

【0751】

* 【0752】

【製剤例】

*

(1) カプセル剤

実施例2の化合物	10 mg
ラクトース	110 mg
コーン・スターチ	58 mg
ステアリン酸マグネシウム	2 mg

180 mg

上記で示される各成分の粉末を良く混合し、60 メッシュの篩（メッシュの基準はTyler基準による）を通す。得られる粉末 180mgをはかり分け、ゼラチン※

※シカプセル (No. 3) に充填し、カプセル剤を調製する。

(2) 錠剤

実施例2の化合物	10 mg
ラクトース	85 mg
コーン・スターチ	34 mg
微結晶セルロース	20 mg
ステアリン酸マグネシウム	1 mg

150 mg

上記で示される各成分の粉末を良く混合し、各 150 mg 重量の錠剤に圧縮成型する。必要ならば、これらの★

★錠剤は糖またはフィルムで被覆してもよい。

(3) 顆粒剤

実施例2の化合物	10 mg
ラクトース	839 mg
コーン・スターチ	150 mg
ヒドロキシプロピルセルロース	1 mg

1000 mg

上記で示される各成分の粉末を良く混合し、純水で湿らし、バスケット式顆粒化機で顆粒化し、乾燥して顆粒剤を得る。

【0753】

【発明の効果】本発明のアミドカルボン酸誘導体、その薬理上許容される塩またはその薬理上許容されるエステルは、糖尿病、高脂血症、肥満症、耐糖能不全症、イン

スリン抵抗性非耐糖能不全症、高血圧症、糖尿病合併症、動脈硬化症、妊娠糖尿病、多嚢胞卵巣症候群、アテローム性動脈硬化症により惹起される細胞損傷、骨関節炎、リウマチ性関節炎、アレルギー性疾患、喘息疾患、癌疾患、自己免疫疾患、膵炎、骨粗鬆症、白内障；神経系疾患；筋ジストロフィー；等の予防剤および／または治療剤として有用である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 7

識別記号

F I

ターマコード* (参考)

A 6 1 P 3/04
3/06
3/10
5/48
5/50
9/10

A 6 1 P 3/04
3/06
3/10
5/48
5/50
9/10

(317)

	1 0 1		1 0 1
9/12		9/12	
11/06		11/06	
15/18		15/18	
19/02		19/02	
19/10		19/10	
21/00		21/00	
21/04		21/04	
25/28		25/28	
27/12		27/12	
29/00		29/00	
	1 0 1		1 0 1
35/00		35/00	
37/02		37/02	
37/08		37/08	
39/06		39/06	
43/00	1 1 1	43/00	1 1 1
// C 0 7 C 233/69		C 0 7 C 233/69	
235/42		235/42	
235/84		235/84	
237/32		237/32	
C 0 7 D 213/56		C 0 7 D 213/56	
213/81		213/81	
(72)発明者 高村 実		Fターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA08 BA13 BA16	
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株		BA34 BA42 BA58 BB01 BB02	
式会社内		BB08 CA02 CA06 CA13 CA42	
(72)発明者 藤原 俊彦		CA58 CB01 CB02 CB08 DA01	
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株		4C086 AA01 AA02 AA03 BC17 BC19	
式会社内		GA08 MA01 MA04 NA14 ZA16	
		ZA33 ZA42 ZA45 ZA59 ZA70	
		ZA94 ZA96 ZA97 ZB07 ZB08	
		ZB11 ZB13 ZB15 ZB22 ZB26	
		ZC20 ZC33 ZC35	
		4C206 AA01 AA02 AA03 DA21 KA01	
		MA01 MA04 MA17 NA14 ZA16	
		ZA33 ZA42 ZA45 ZA59 ZA70	
		ZA94 ZA96 ZA97 ZB07 ZB08	
		ZB11 ZB13 ZB15 ZB22 ZB26	
		ZC20 ZC33 ZC35	
		4H006 AA03 AB20 AB21 AB23 AB26	
		AB27 AB28 BJ50 BN30 BP30	
		BQ30 BS30 BT12 BU46 BV72	